



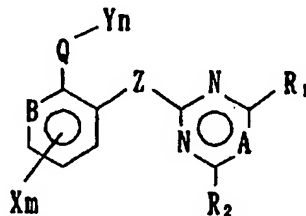
特許協力条約に基づいて公開された国際出願

BEST AVAILABLE COPY

(51) 国際特許分類 5 C07D 401/14, 403/10, 403/12, 413/10, 413/12, 417/10, 417/12, A01N 43/48, 43/647, 43/72	AI	(11) 国際公開番号 WO 94/17059 (43) 国際公開日 1994年8月4日 (04.08.94)
(21) 国際出願番号 PCT/J P94/00109 (22) 国際出願日 1994年1月27日 (27. 01. 94) (30) 優先権データ 特願平 5/34696 1993年1月29日 (29. 01. 93) JP (71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 日本曹達株式会社 (NIPPON SODA CO., LTD.) (JP/JP) 〒100 東京都千代田区大手町2丁目2番1号 Tokyo, (JP) (72) 発明者; および (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ) 宮澤靖之 (MIYAZAWA, Yasuyuki) (JP/JP) 原 良彦 (HARA, Yoshihiko) (JP/JP) 植田昭嘉 (UEDA, Akiyoshi) (JP/JP) 古口正己 (KOBUCHI, Masami) (JP/JP) 富田和之 (TOMIDA, Kazuyuki) (JP/JP) 川名 貴 (KAWANA, Takashi) (JP/JP) 〒250-02 神奈川県小田原市高田字柳町345 日本曹達株式会社 小田原研究所内 Kanagawa, (JP) (74) 代理人 弁理士 東海裕作, 外 (TOKAI, Yusaku et al.) 〒100 東京都千代田区大手町2丁目2番1号 日本曹達株式会社内 Tokyo, (JP)	(81) 指定国 AT, AU, BB, BG, BR, CA, CH, CN, CZ, DE, DK, ES, FI, GB, HU, JP, KR, LK, LU, MG, MN, MW, NL, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SK, UA, US, 欧州特許 (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG). 添付公開書類 国際調査報告書 請求の範囲の補正の期限前であり、補正書受領の際には再公開される。	

(54) Title: HETEROCYCLIC DERIVATIVE

(54) 発明の名称 複素環誘導体

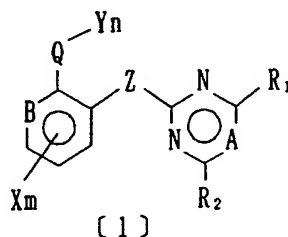


(57) Abstract

A compound having improved herbicidal and plant growth regulating effects and represented by general formula (1), wherein A represents nitrogen or R₃-substituted carbon; B represents nitrogen or carbon which may be substituted by X; Z represents oxygen, optionally oxidized sulfur, nitrogen or carbon; Q represents a 5- or 6-membered heterocycle having one to four nitrogen, oxygen or sulfur atoms, and is bonded to the benzene or pyridine ring via its carbon atom; R₁ and R₂ represent each hydrogen, alkyl, alkoxy, haloalkoxy, haloalkyl, alkylamino, dialkylamino, alkylthio, halogen or cyano; R₃ represents hydrogen, alkyl, halogen, nitro, formyl or acyl, or alternatively R₂ and R₃ may be combined together to form a ring; X and Y represent each hydrogen, alkyl, cycloalkyl, alkenyl, haloalkyl, alkynyl, halogen, nitro, amino, alkylamino, etc.; and m and n represent each an integer of 1 to 4.

(57) 要約

本発明は改善された除草作用並びに植物生長調整作用を有する化合物に関し、それは一般式〔I〕で表される。



〔式中、AはN、R₃で置換された炭素、BはN、又はHもしくはXで置換された炭素、ZはO、酸化されていても良いS、N、炭素、QはN、O、Sを1～4個含む5～6員の複素環を表し、Qの炭素でベンゼン環もしくはピリジン環部と結合しており、R₁、R₂はH、アルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロアルキル、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルチオ、ハロゲン、シアノ、R₃はH、アルキル、ハロゲン、ニトロ、ホルミル、アシル基、又、R₂とR₃で環を形成していても良く、X、YはH、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、ハロアルキル、アルキニル、ハロゲン、ニトロ、アミノ、アルキルアミノ等、m、nは1～4の整数〕

情報としての用途のみ

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第1頁にPCT加盟国を同定するために使用されるコード

AM	アルメニア	CZ	チェッコ共和国	KP	朝鮮民主主義人民共和国	NZ	ニュー・ジーランド
AT	オーストリア	DE	ドイツ	KR	大韓民国	PL	ポーランド
AU	オーストラリア	DK	デンマーク	KZ	カザフスタン	PT	ポルトガル
BB	バルバドス	EE	エストニア	LI	リヒテンシュタイン	RO	ルーマニア
BE	ベルギー	ES	スペイン	LK	スリランカ	RU	ロシア連邦
BF	ブルキナ・ファソ	FI	フィンランド	LT	リトアニア	SD	スーダン
BG	ブルガリア	FR	フランス	LU	ルクセンブルグ	SE	スウェーデン
BJ	ベナン	GA	ガボン	LV	ラトヴィア	SI	スロヴェニア
BR	ブラジル	GB	イギリス	MC	モナコ	SK	スロヴァキア共和国
BY	ベラルーシ	GE	グルジア	MD	モルドバ	SN	セネガル
CA	カナダ	GN	ギニア	MG	マダガスカル	TD	チャード
CF	中央アフリカ共和国	GR	ギリシャ	ML	マリ	TG	トーゴ
CG	コンゴ	HU	ハンガリー	MN	モンゴル	TJ	タジキスタン
CH	スイス	IE	アイルランド	MR	モーリタニア	TT	トリニダード・トバゴ
CI	コート・ジボアール	IT	イタリア	MW	マラウイ	UA	ウクライナ
CM	カメルーン	JP	日本	NE	ニジェール	US	米国
CN	中国	KE	ケニア	NL	オランダ	UZ	ウズベキスタン共和国
CS	チェコスロヴァキア	KG	キルギスタン	NO	ノルウェー	VN	ベトナム

明 細 書

複素環誘導体

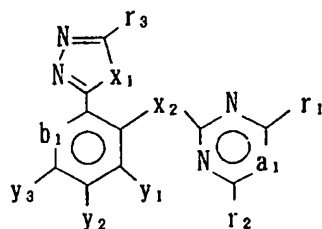
技術分野：

本発明は、新規な複素環誘導体、その製造方法及び該誘導体を有効成分として含有する除草剤に関するものである。

背景技術：

農園芸作物の栽培にあたり、多大の労力を必要としてきた雑草防除に多くの除草剤が使用されるようになってきた。しかし作物に薬害を生じたり、環境に残留したり、汚染したりすることから、より低い薬量で効果が確実でしかも安全に使用できる薬剤の開発が望まれている。

本発明化合物に関連するピリミジルオキシ置換サリチル酸及びその硫黄同族体は、文献（例えば、特開昭59-59669、特開昭62-174059、特開平3-232884、特開平4-77487）に記載されているが、選択性も含めた除草剤としては満足すべきものではない。また下記化合物が、特開平5-202038（1993年8月10日発行）に除草作用を有することが記載されている。

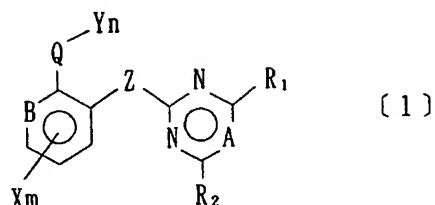


〔式中、 r_1 、 r_2 は低級アルキル基、低級アルコキシ基等、 r_3 は低級アルキル基等、 x_1 、 x_2 はOまたはS、 a_1 はCHまたはN、 y_1 、 y_2 及び y_3 はH等、 b_1 はCH、Nを表す。〕

発明の開示：

本発明の目的は工業的に有利に合成でき、より低い薬量で効果の確実な安全性の高い、作物との選択性の良い除草剤を提供することである。

本発明は、一般式〔1〕

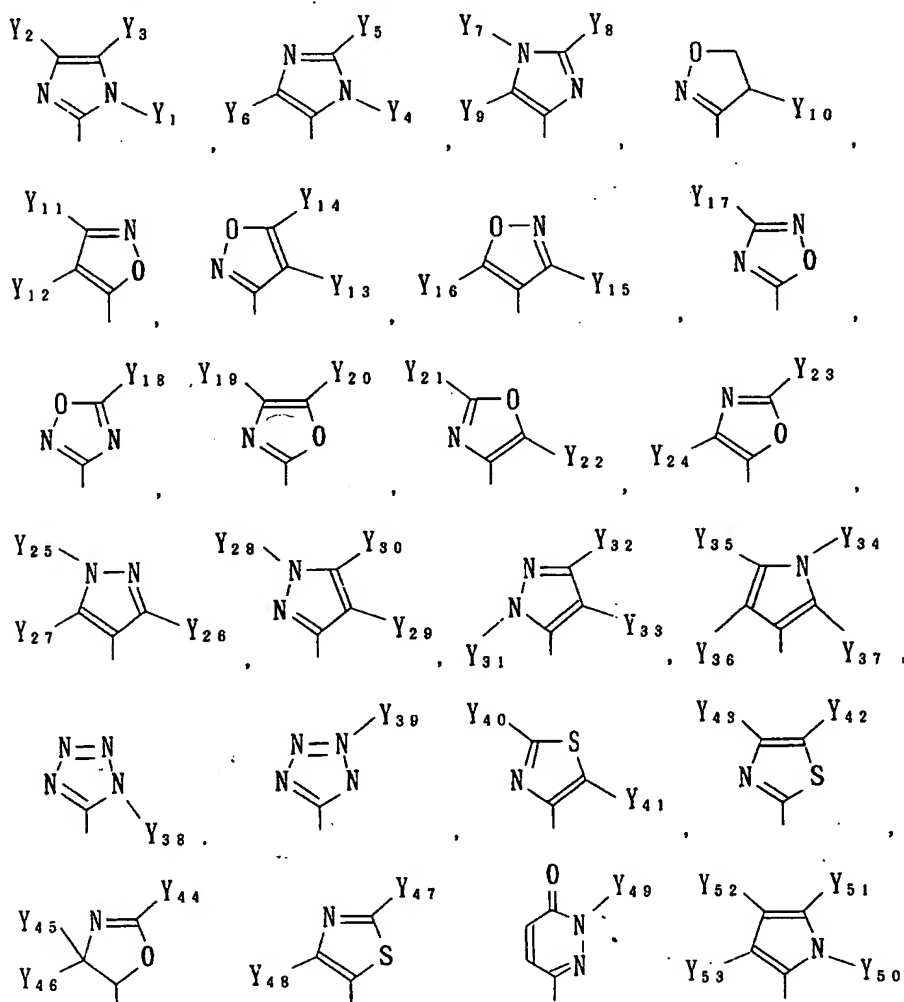


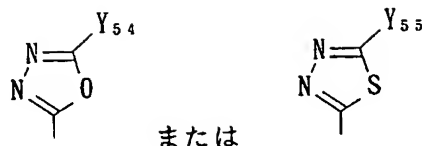
〔式中、Aは窒素原子、もしくはR₃で置換された炭素原子を表し、
 Bは窒素原子、又は水素もしくはXで置換された炭素原子を表し、
 Zは酸素、酸化されていても良い硫黄、置換されていても良い窒素、又は置換されていても良い炭素原子を表し、
 Qは窒素、酸素もしくは硫黄を1～4個含む5～6員の複素環を表し、かつQの炭素原子でベンゼン環もしくはピリジン環部と結合しており、
 R₁、R₂は各々独立して水素、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄ハロアルコキシ、C₁₋₄ハロアルキル、C₁₋₄アルキルアミノ、ジC₁₋₄アルキルアミノ、C₁₋₄アルキルチオ、ハロゲン、シアノ基を表し、
 R₃は水素、C₁₋₄アルキル、ハロゲン、ニトロ、ホルミル、アシル基を表し、
 又、R₂とR₃は一緒になって環を形成していても良く、
 X、Yは各々独立して水素、C₁₋₆アルキル、C₃₋₇シクロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルキニル、ハロゲン、ニトロ、アミノ、C₁₋₆アルキルアミノ、アシルアミノ、C₁₋₆アルキルスルホニルアミノ、ホルミル、アシル、シアノ、カルボキシル、イミノ、ヒドロキシル、C₁₋₆アルコキシカルボニル、C₁₋₆アルコキシ、置換されても良いベンジルオキシ、C₂₋₆アルケニルオキシ、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₂₋₆アルキニルオキシ、置換されても良いフェノキシ、置換されても良いベンジル、アミノオキシ、C₁₋₆アルキルチオ、置換されても良いフェニル、C₁₋₆アルキルスルホニル、置換されても良いフェニルチオ、C₂₋₆アルケニルチオ、C₂₋₆アルキニルチオ、置換されても良いベンゾイル、置換されても良いフェニルスルホニル、置換されても良いヘテロ環ーオキシおよびヘテロ環ーチオ基を表し、

又、2つのXもしくは2つのYで炭素環、又は複素環を形成してもよく、
 m, nは1～4の整数を表す。〕で表される複素環誘導体もしくはその塩、これ
 を製造する方法およびこれを含有する除草剤である。

Qの窒素、酸素もしくは硫黄を1～4個含む5～6員の複素環としては、例えば、
 イミダゾール、イソオキサゾール、オキサゾール、オキサジアゾール、ピロ
 ール、ピラゾール、チアゾール、チアジアゾール、テトラゾール、トリアゾール、
 ジチアゾール、ピリミジン、ピリジン、ピラジン、オキサジン、ピリダジン、ピ
 ロン、トリアジン、これらのヘテロ環のジヒドロ体等である。

さらに具体的にはQ-Y_nは、

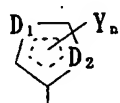




〔式中、 $Y_1 \sim Y_{55}$ は水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-7} シクロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルキニル、ハロゲン、ニトロ、アミノ、 C_{1-6} アルキルアミノ、アシルアミノ、 C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ、ホルミル、アシル、シアノ、カルボキシル、イミノ、ヒドロキシル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、 C_{1-6} アルコキシ、置換されても良いベンジルオキシ、 C_{2-6} アルケニルオキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルキニルオキシ、置換されても良いフェノキシ、置換されても良いベンジル、アミノオキシ、 C_{1-6} アルキルチオ、置換されても良いフェニル、 C_{1-6} アルキルスルホニル、置換されても良いフェニルチオ、 C_{2-6} アルケニルチオ、 C_{2-6} アルキニルチオ、置換されても良いベンゾイル、置換されても良いフェニルスルホニル、又は置換されても良いヘテロ環ーオキシおよびヘテロ環ーチオ基を表し、

又、2つの $Y_1 \sim Y_{55}$ で炭素環、又は複素環を形成してもよい。〕等である。

そして、好ましくは、 $Q-Y_n$ は、



〔式中、 ----- は単結合または二重結合を表し、

D_1 がNの時は、 D_2 はNY又はOを表し、

D_1 がNYの時は、 D_2 はCYを表し、

D_1 がOの時は、 D_2 はNを表し、

Y及びnは前記と同じ意味を表す。〕である。

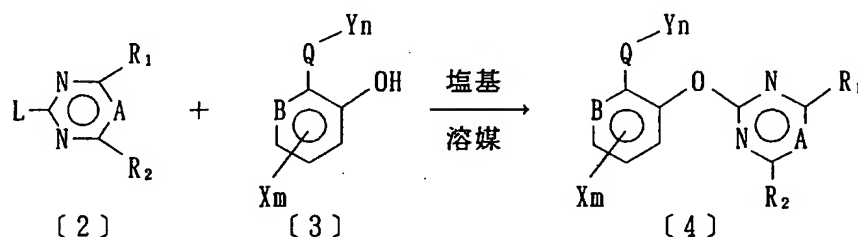
これらのうち、Qとしては、オキサゾールー5ーイル又は2ーオキサゾリノー

5ーイル基が特に好ましい。

前記X、Y中のベンジルオキシ、フェノキシ、ベンジル、フェニル、フェニルチオ、ベンゾイル、フェニルスルホニル、ヘテロ環ーオキシ、ヘテロ環ーチオ基を置換する基としては、C₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₆ アルキル、ハロゲン、ニトロ、C₁₋₆ アルキルチオ、C₁₋₆ アルキルスルホニル、C₁₋₆ ハロアルキル、シアノ、フェニル、アミノ、C₁₋₆ アルキルアミノ、ジ-C₁₋₆ アルキルアミノ、カルバモイル、C₁₋₆ アルコキシカルボニル等が挙げられ、また2つの置換基で環を形成してもよい。

本発明の化合物は、次の方法によって製造することが出来る。

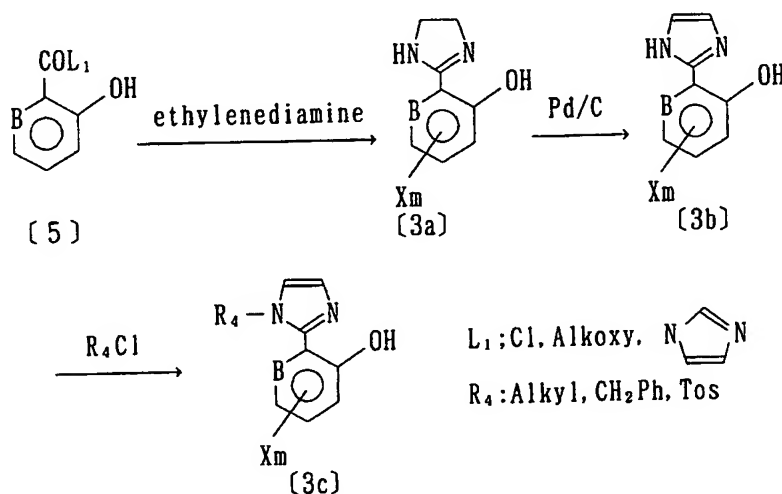
(製造法-1)



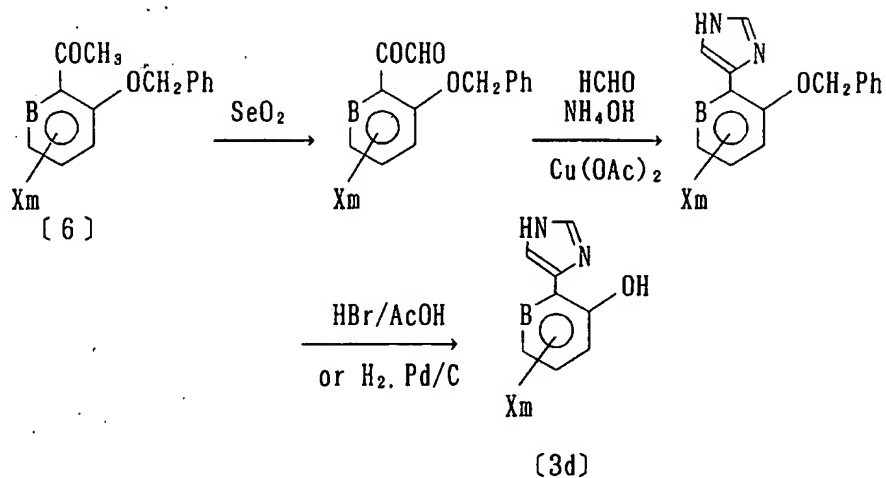
一般式〔2〕(式中、R₁、R₂、Aは前記と同じ意味を表し、Lはハロゲン、アルキルスルホニル基、アールスルホニル基等の脱離基を表す。)の化合物と、一般式〔3〕(式中、B、Q、X、Y、m、nは前記と同じ意味を表す。)の化合物を、有機溶媒中で塩基の存在下カップリングさせる。塩基としては、水素化ナトリウム等の水素化金属類、炭酸カリウム等の炭酸塩類、トリエチルアミン等の有機塩基類などであり、溶媒としては、DMF、DMSO、THF、DME等が挙げられる。反応混合物は反応が完了するまで、0～90℃、場合によっては120℃で撹拌される。

上記の反応における原料のo-ヘテロ環置換フェノール(あるいは、ヒドロキシピリジン)誘導体〔3〕は以下に述べるような方法により製造することができる。尚、特に指定をしていない場合に於いては以下の反応で用いられる溶媒としては、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハ

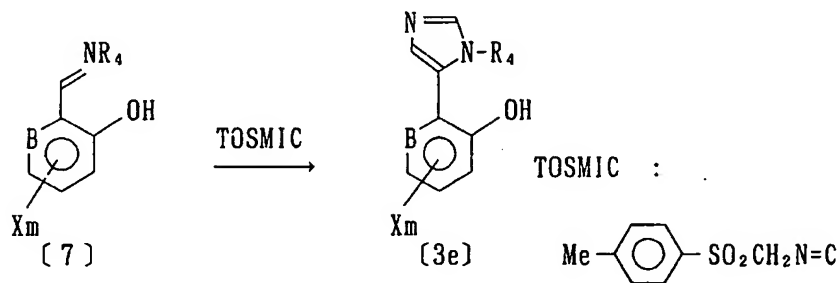
ロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、アセトン、MEK等のケトン類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、DMF、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、アセトニトリル等のニトリル類、水等が挙げられる。又、用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類、水素化ナトリウム等の水素化金属類、ブチルリチウム等のアルキル金属類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビストリメチルシリルアミド等のリチウムアミド類、トリエチルアミン、DBU等の有機塩基類等が挙げられる。又、用いられる酸としては塩酸、硝酸、硫酸等の鉱酸類、蟻酸、酢酸等の有機酸類、塩化アルミニウム、ボロントリフロリドジエチルエーテル等のルイス酸類などが挙げられる。又、反応温度としては、 -90°C ～溶媒の沸点以下の温度が挙げられる。(以下、式中X, m, Bは前記と同じ意味を表す。)



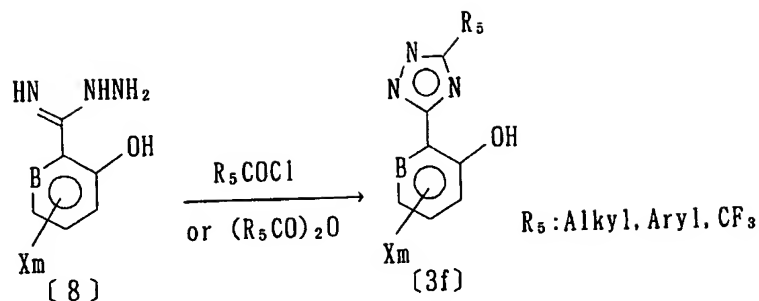
Qがイミダゾリン-2-イルの化合物〔3a〕とイミダゾール-2-イルの化合物〔3b, c〕は、J. Amer. Chem. Soc. 96巻、2463ページ(1974年)に記載の方法を応用して製造することができる。(式中、L₁はアルコキシ、Cl, 1-イミダゾール基を表し、R₄はアルキル、ベンジル、p-トルエンシルホニル基(Tos)を表す。)



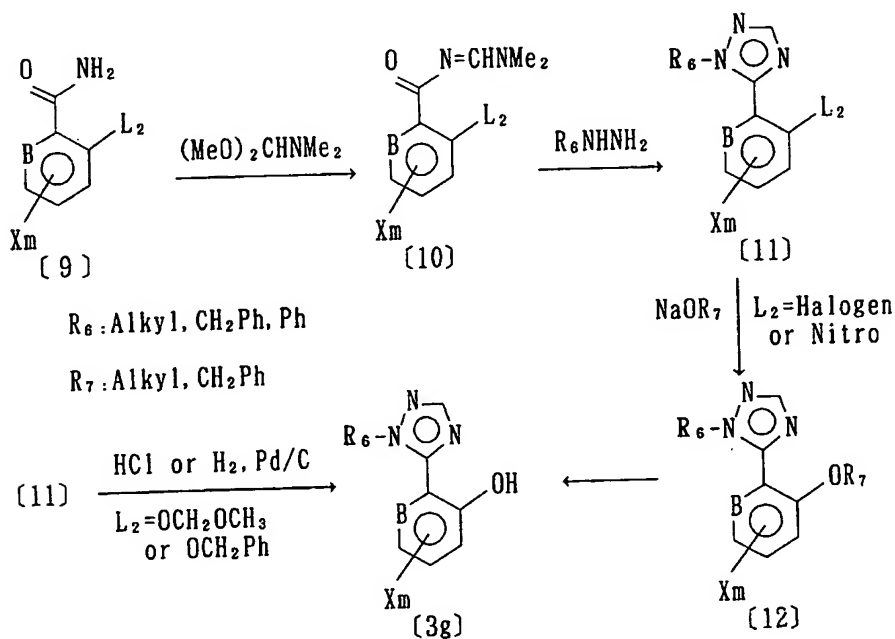
Qがイミダゾール-4-イルの化合物〔3d〕はJ. Amer. Chem. Soc. 82巻、3386ページ（1960年）に記載の方法を応用して製造することができる。



あるいは、Qがイミダゾール-4-イルの化合物は、イミン〔7〕とTosMIC（p-トルエンスルホニルメチルイソシアニド）を、塩基の存在下反応させることにより製造することができる。詳細は、J. Org. Chem. 42巻、1153ページ（1977年）に記載されている。（式中、 R_4 は前記と同じ意味を表す。）



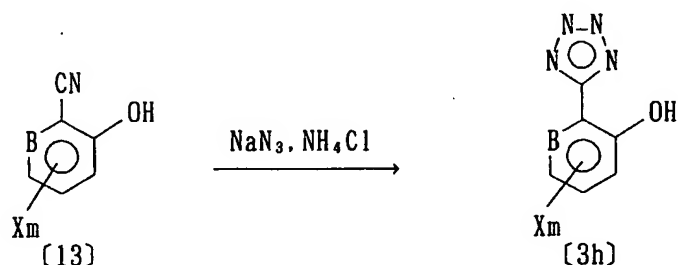
Qが1, 3, 4-トリアゾール-2-イルの化合物〔3f〕は、化合物〔8〕を酸クロライドもしくは、酸無水物とDMF中、0～120℃で反応させることにより製造することができる。(式中R₅はアルキル、アリアル、CF₃基を表す。)



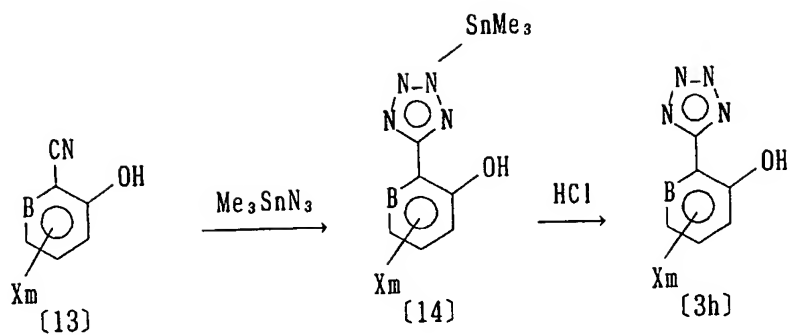
3位置換-1, 3, 4-トリアゾール-2-イル誘導体〔3g〕はJ. Org. Chem. 44巻、4160ページ(1979年)の教えに従い、アミド〔9〕とジメチルホルムアミド、ジメチルアセタールを反応させて、N-〔(ジメチルアミノ)メチレン〕アミド〔10〕を合成する。〔10〕にヒドラジン類を反応

させて、トリアゾール〔11〕へと誘導する。 L_2 がメトキシメトキシ、ベンジルオキシ基の場合は、〔11〕を酸で処理するか、パラジウム炭素等を触媒にした加水素化分解反応によって〔3g〕が得られる。

L_2 がハロゲン、ニトロの場合には、〔11〕にナトリウムアルコラートを反応させて、化合物〔12〕を合成する。〔12〕から〔3g〕への変換は、"Protective Groups in Organic Synthesis" T. W. Greene編集、JOHN WILEY & SONS, N. Y. 発行、第3章87ページに記載の方法から、適切な反応を選択して行われるが、例えば、1) $LiCl$ 等の塩をDMFやDMSO等の溶媒中で、加熱する方法。2) HBr /酢酸中加熱する方法。3) ピリジン塩酸塩中加熱する方法。4) 金属触媒を用いた加水素化分解による方法。5) ボロントリハライド等のルイス酸による脱アルキル化等が挙げられる。(式中 L_2 はメトキシメトキシ、ベンジルオキシ、ニトロ基、ハロゲンを表し、 R_6 はアルキル、ベンジル、フェニル基を表し、 R_7 はアルキル、ベンジル基を表す。)

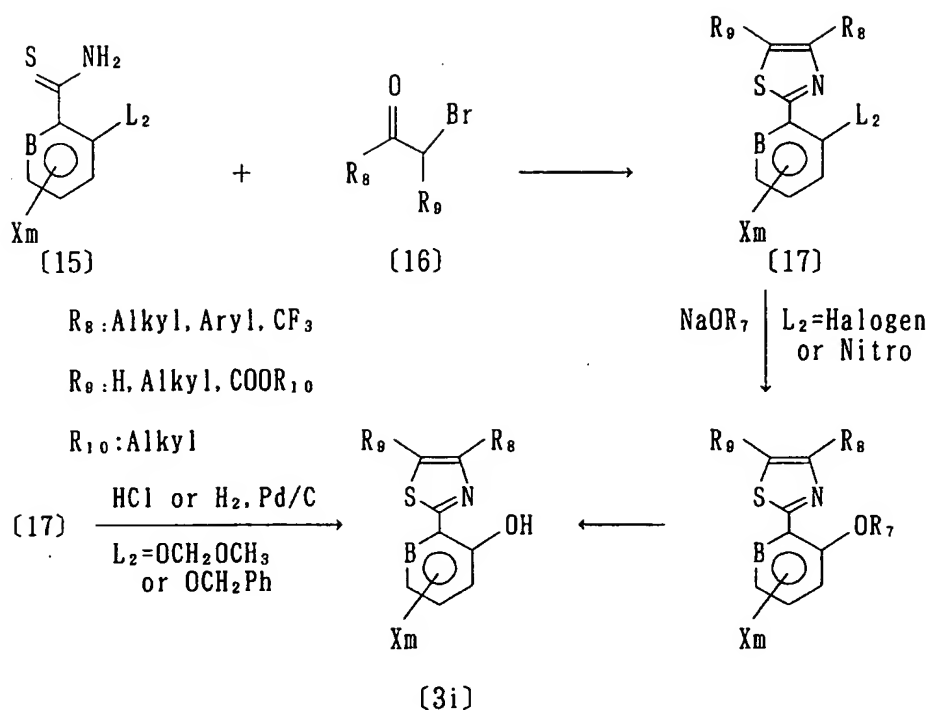


Qがテトラゾール-5-イルの誘導体は、J. Amer. Chem. Soc. 80巻、3908ページ(1958年)の方法を応用して、ニトリル〔13〕にアジ化ナトリウムと塩化アンモニウムをDMF中80~140℃で1~48時間反応させることにより製造できる。



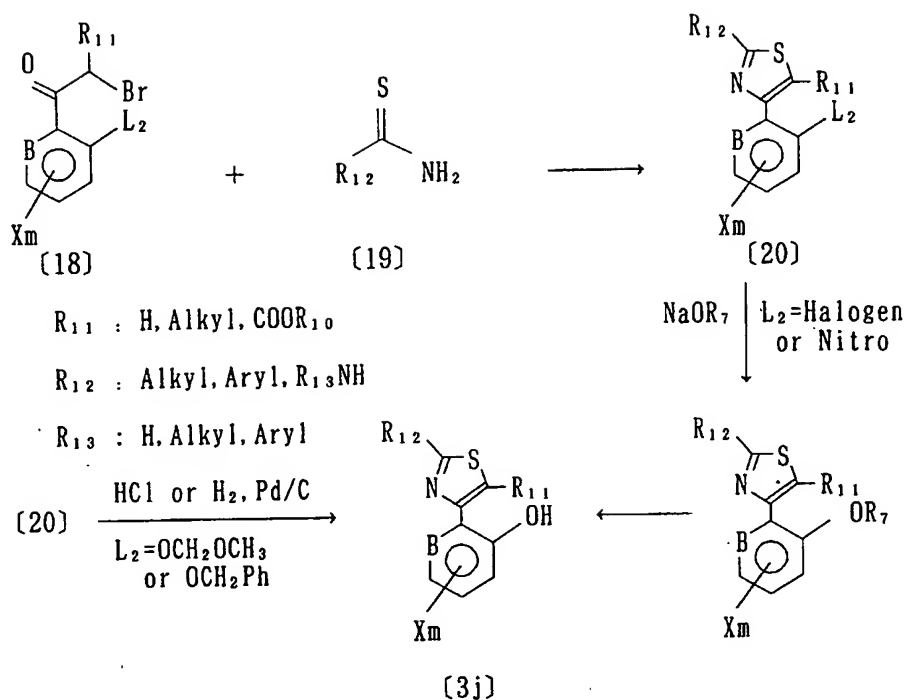
[3h] は J. Org. Chem. 56 巻、2395 ページ (1991 年) に記載されている方法により、スズアジドと [13] を反応させても製造することができる。

11



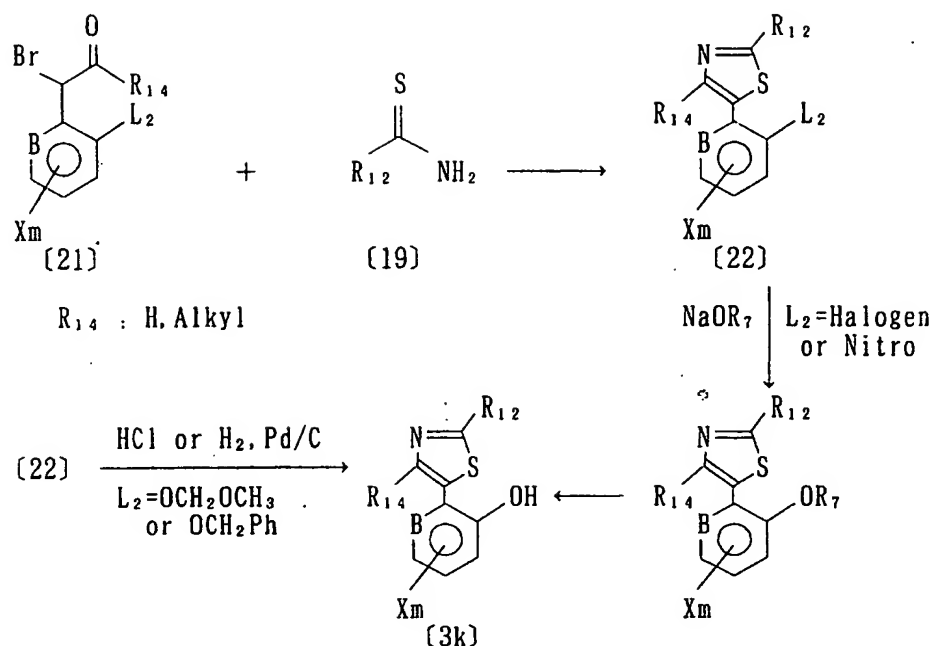
Qがチアゾール-2-イルの誘導体は以下のようにして合成される。チオアミド〔15〕とプロモケトン〔16〕をアルコール中25～80℃で、1～20時間反応させて〔17〕を合成する。次いで〔17〕から〔3g〕の製造法と同様の反応を行うことによって〔3i〕が製造される。（式中、 R_8 はアルキル、アリール、 CF_3 基を表し、 R_9 は水素、アルキル、 COOR_{10} 基を表し、 R_{10} はアルキル基を表し、 L_2 、 R_7 は前記と同じ意味を表す。）

12



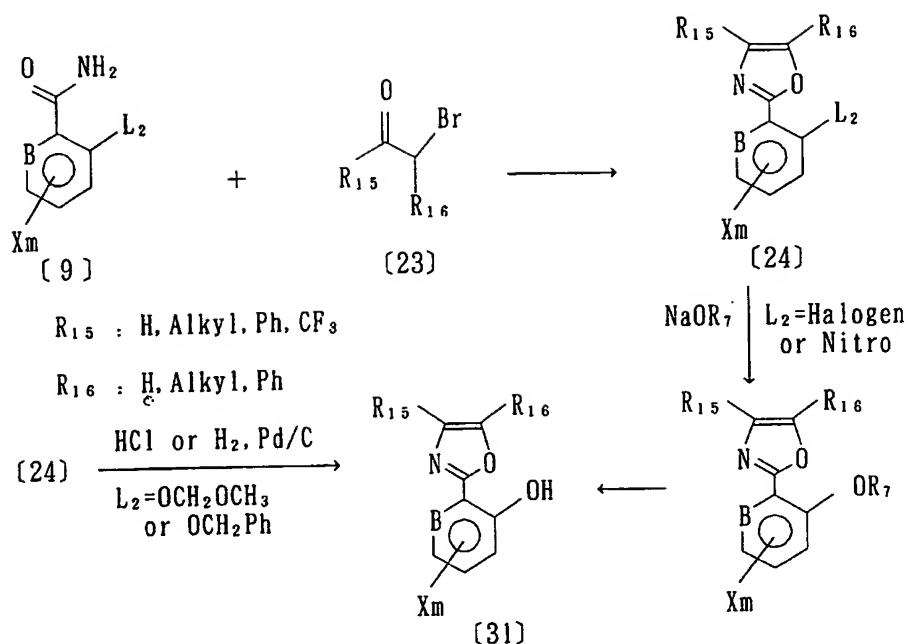
Qがチアゾール-4-イルの誘導体〔3j〕は、〔19〕とプロモケトン〔18〕をアルコール中25～80℃で、1～20時間反応させてチアゾール環を形成した後に、〔3g〕の製造法と同様の反応を行うことにより製造される。

（式中、R₁₁は水素、アルキル、COOR₁₀基を表し、R₁₂はアルキル、アリール、R₁₃NH基を表し、R₁₃は水素、アルキル、アリール基を表し、L₂、R₇、R₁₀は前記と同じ意味を表す。）

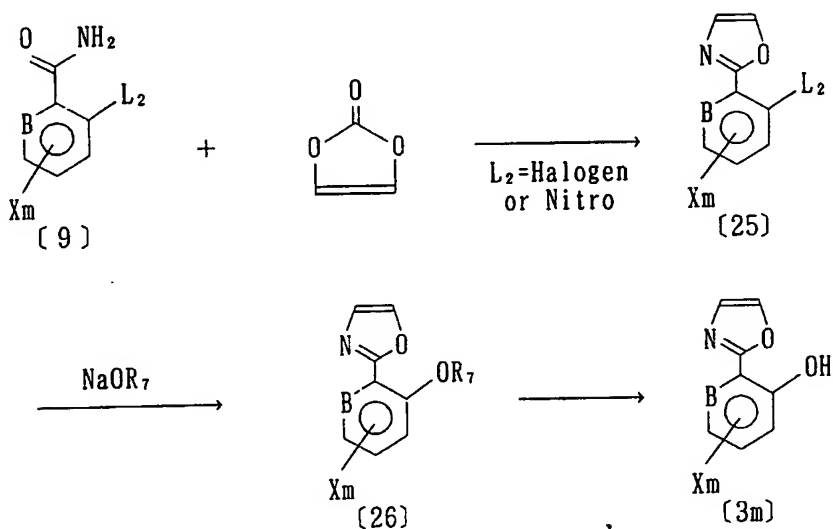


Qがチアゾール-5-イルの誘導体〔3k〕も、前述と同様の方法によって製造することが出来る。（式中 R_{14} は水素、アルキル基を表し、 L_2 、 R_7 、 R_{12} は前記と同じ意味を表す。）

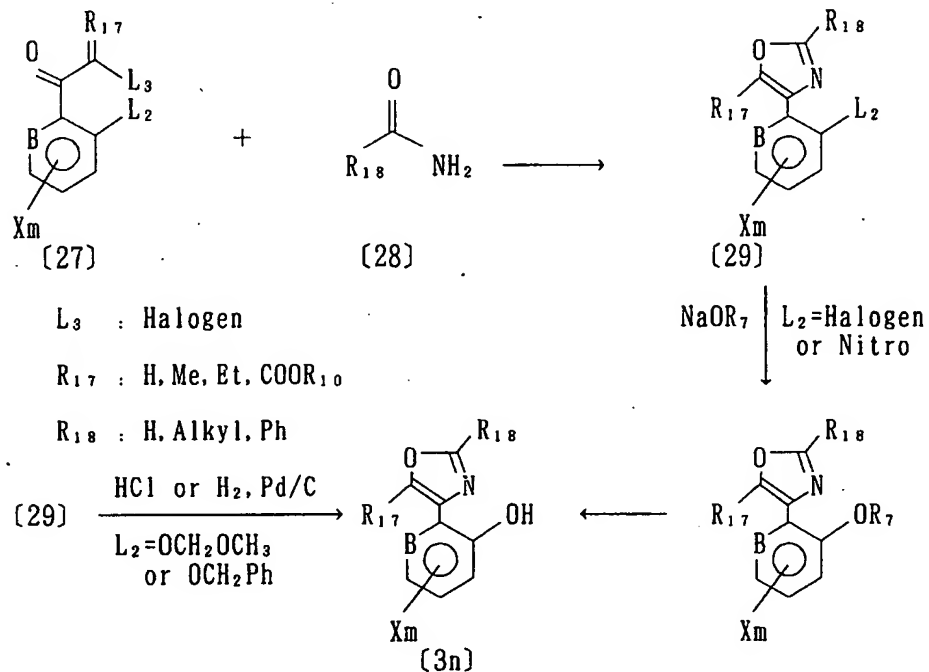
尚、これらのチアゾール誘導体〔3i~k〕の合成法は、Chem. Heterocyclic Compounds, 34巻、パート1~3（1978~1979年）、あるいは、“Heterocyclic Compounds” R. C. Elderfield編集、WILEY, N. Y. 発行、5巻、484~722ページ（1957年）に記載されている。



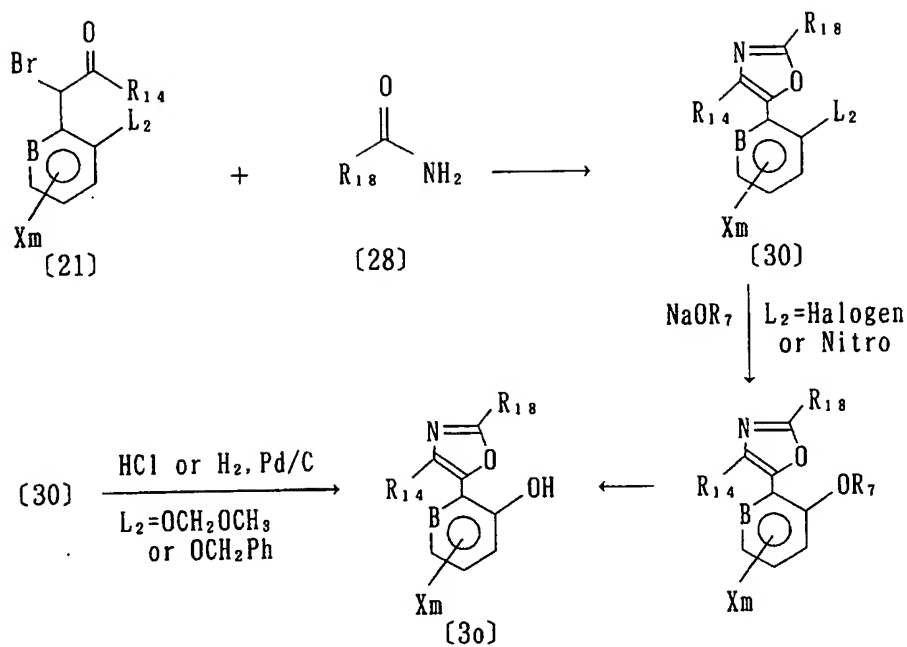
Qがオキサゾール-2-イルの誘導体〔31〕はアミド〔9〕とプロモケトン〔23〕を50～160℃で1～48時間反応させて〔24〕とした後に〔3g〕の製造法と同様の反応を行うことにより製造することが出来る。（式中、 R_{15} は水素、アルキル、フェニル、 CF_3 基を表し、 R_{16} は水素、アルキル、フェニル基を表し、 L_2 、 R_7 は前記と同じ意味を表す。）



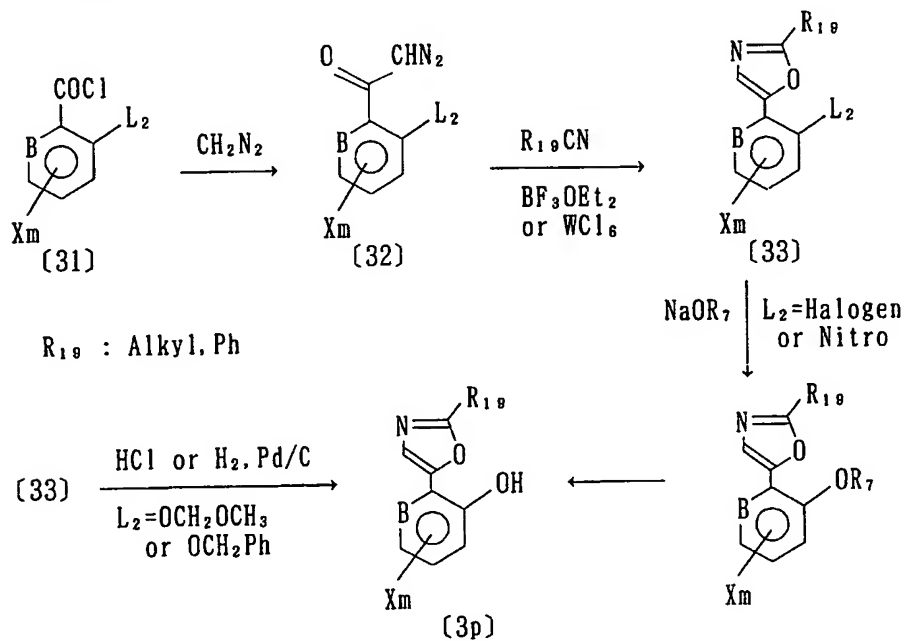
〔9〕とビニレンカルボネートとの反応により化合物〔25〕を合成し、〔26〕を経て〔3g〕の製造法と同様の反応を行うことにより、〔3m〕が得られる。(式中、 L_2 、 R_7 は前記と同じ意味を表す。)



Qがオキサゾール-4-イルの誘導体も〔31〕と同様の反応により得られる。化合物〔27〕とアミド〔28〕を50～160℃で1～48時間反応させてオキサゾール誘導体〔29〕を得た後、〔29〕より〔3g〕の製造法と同様の反応を行うことにより〔3n〕を製造することが出来る。(式中、 L_3 はハロゲンを表し、 R_{17} は水素、メチル、エチル基、 COOR_{10} を表し、 R_{18} は水素、アルキル、フェニル基を表し、 L_2 、 R_7 、 R_{10} は前記と同じ意味を表す。)

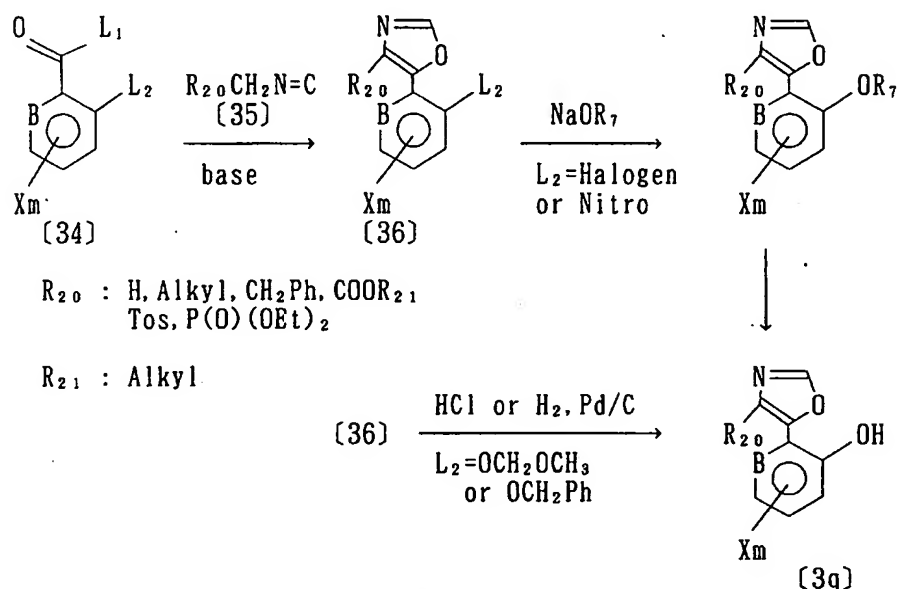


Qがオキサゾール-5-イルの誘導体〔30〕は、プロモケトン〔21〕とアミド〔28〕より得られる〔30〕を〔3g〕の製造法と同様の反応を行うことにより、製造される。(式中、L₂, R₇, R₁₄, R₁₈は前記と同じ意味を表す。)

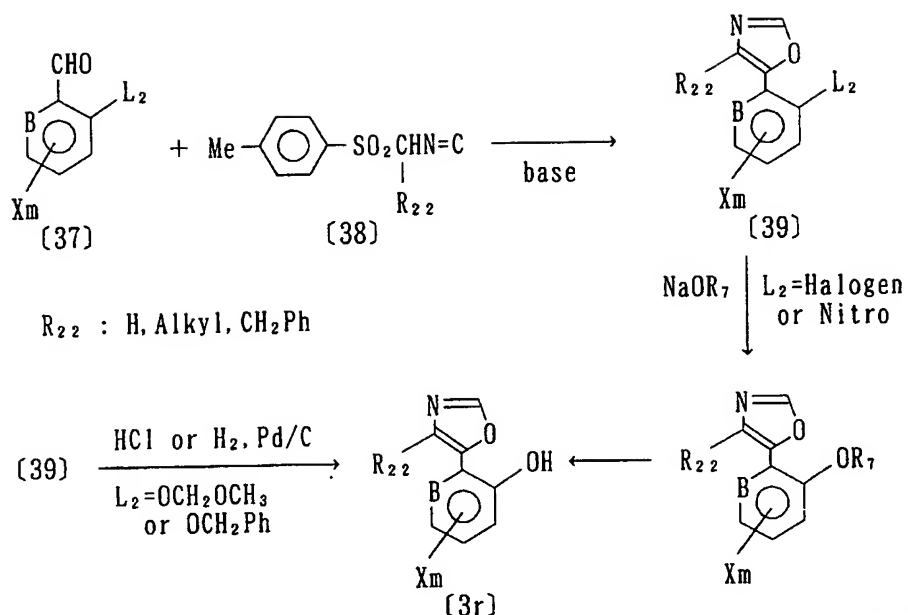


酸クロリド〔31〕をジアゾケトン〔32〕に誘導した後に、適当なルイス酸

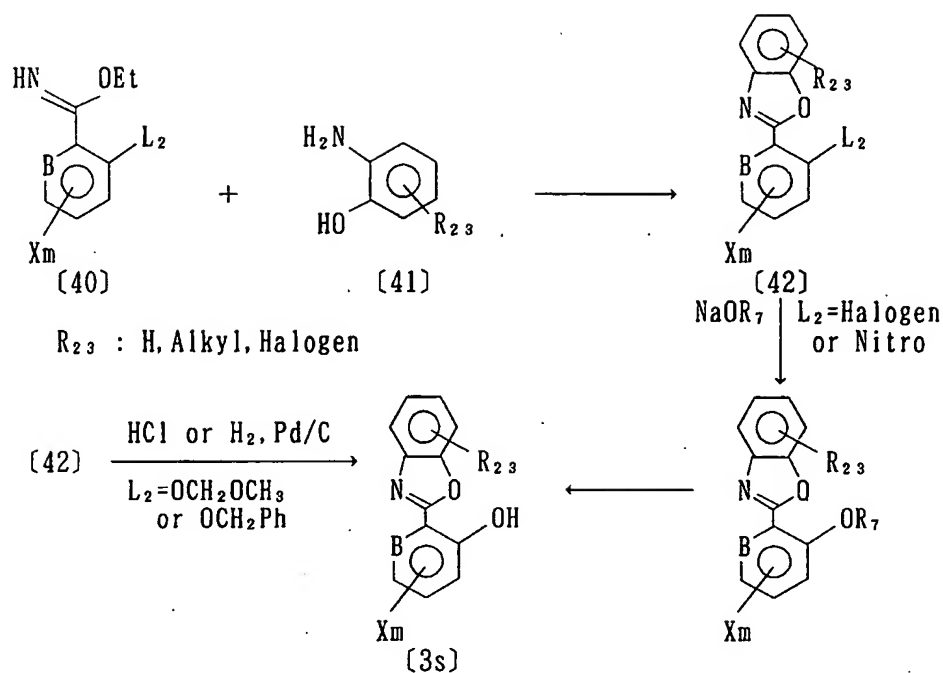
の存在下、ニトリル類と反応させることにより、オキサゾール-5-イル誘導体〔33〕が得られる。〔33〕から〔3p〕への変換は〔3g〕の製造法と同様の反応を行うことにより達成される。（式中、 R_{10} はアルキル、フェニル基を表し、 L_2 、 R_7 は前記と同じ意味を表す。）



化合物〔34〕とイソニトリル類〔35〕を、ブチルリチウムや水素化ナトリウム等の塩基の存在下、 $-78 \sim 80^\circ C$ で0.5～24時間反応させることにより、化合物〔36〕を得る。〔36〕を〔3g〕の製造法と同様の反応を行うことにより、〔3q〕を製造することができる。（式中、 R_{20} は水素、アルキル、ベンジル、フェニル基、 $COOR_{21}$ 、Tos、リン酸エステル基を表し、 R_{21} はアルキル基を表し、 L_1 、 L_2 、 R_7 は前記と同じ意味を表す。）

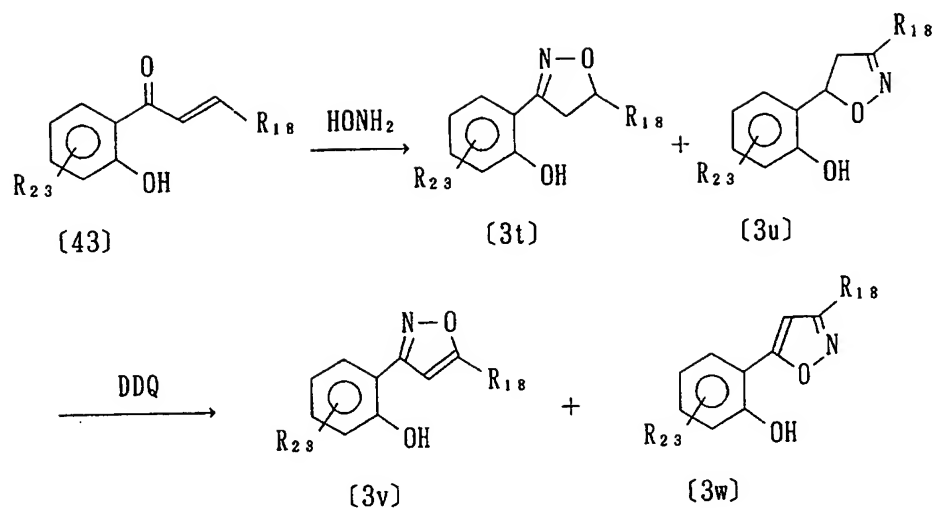


Qがオキサゾール-5-イルの誘導体〔3r〕は次の方法によっても製造される。即ち、アルデヒド〔37〕にイソニトリル〔38〕を炭酸カリウムや水素化ナトリウム等の塩基の存在下、25～100℃で0.5～8時間反応させることで〔39〕を得た後、〔3g〕の製造法と同様の反応を行う方法である。（式中、 R_{22} は水素、アルキル、ベンジル基を表し、 L_2 、 R_7 は前記と同じ意味を表す。）

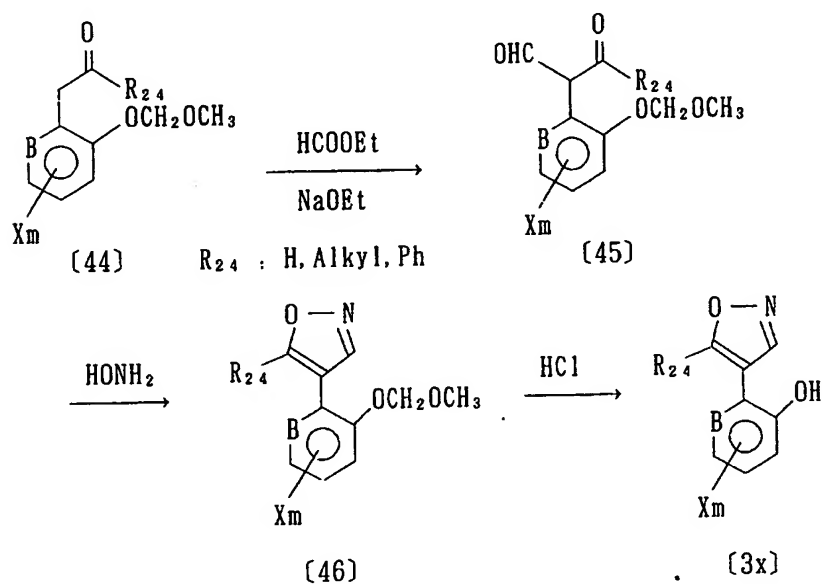


Qが縮合オキサゾール-2-イルの誘導体〔3s〕は化合物〔40〕にアミノフェノール〔41〕を反応させることにより、化合物〔42〕を経て、〔3g〕の製造法と同様の反応を行うことにより、製造される。（式中、 R_{23} は水素、アルキル基、ハロゲンを表し、 L_2 、 R_7 は前記と同じ意味を表す。）

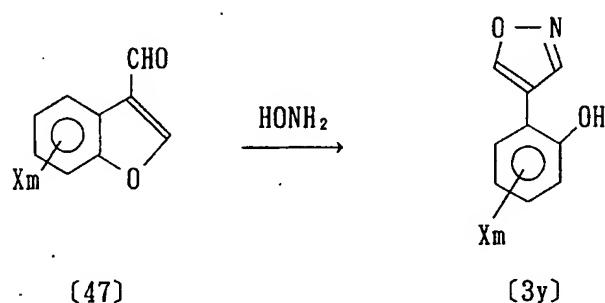
尚、オキサゾール誘導体〔31～s〕の製造法に関する著書としては多数あるが、"Heterocyclic Compounds" 45巻、I. J. Turchi編集、JOHN WILEY, N. Y. 発行（1986年）及び、"Heterocyclic Compounds" R. C. Elderfield編集、WILEY, N. Y. 発行、5巻、298～451頁（1957年）に記載の方法、文献を参考にすることができる。



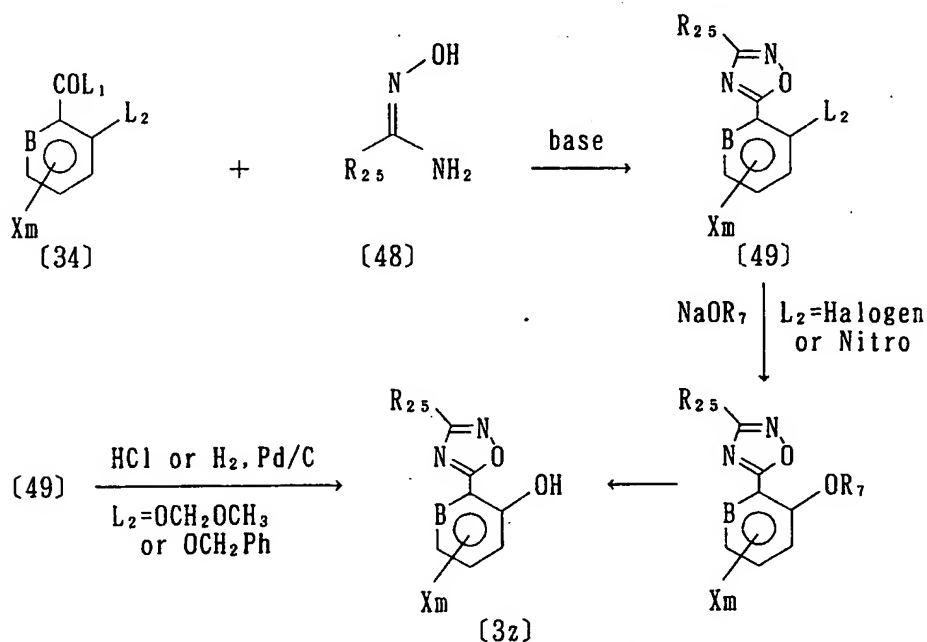
化合物〔43〕とヒドロキシルアミンをエタノール中、 $50 \sim 70^\circ\text{C}$ で0.5～8時間反応させることでイソオキサゾール-3-イル体〔3t〕とイソオキサゾリン-5-イル体〔3u〕の混合物が得られる。〔3t〕と〔3u〕はクロマトグラフィーや再結晶により、容易に分離できる。〔3t〕と〔3u〕と各々DDQ等の酸化剤によって酸化することで、イソオキサゾール-3-イル体〔3v〕及び、イソオキサゾール-5-イル体〔3w〕を製造することが出来る。(式中、 R_{18} 、 R_{23} は前記と同じ意味を表す。)



Qがイソオキサゾール-4-イルの誘導体〔3x〕は、化合物〔44〕をホルミル化して〔45〕とした後に、ヒドロキシルアミンによって環化させ、最後にフェノールの保護基を外すことにより製造される。この反応の参考文献としては、薬学雑誌、79巻、623頁（1959年）が挙げられる。（式中、 R_{24} は水素、アルキル、フェニル基を表す。）

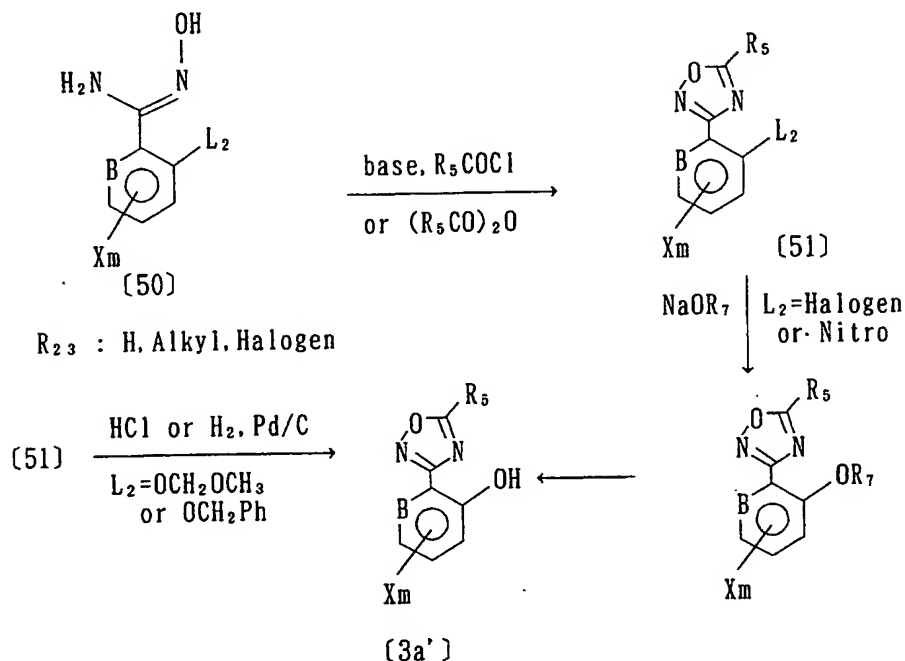


あるいは、ベンゾフラン〔47〕とヒドロキシルアミンとをアルコール中、25～80℃で0.5～8時間反応させることで〔3y〕を製造することが出来る。

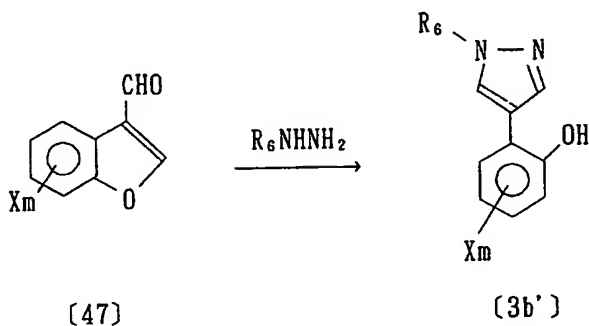


1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イルの誘導体〔3z〕は、〔34〕とアミドキシム〔48〕とを塩基の存在下、0～140℃で1～8時間反応させて〔49〕とした後に、〔3g〕の製造法と同様の反応を行うことにより、製造さ

れる。(式中、 R_{25} は水素、アルキル、ベンジル、アリール、ハロアルキル、アルコシアルキル、アルキルチオアルキルを表し、 L_1 , L_2 , R_7 は前記と同じ意味を表す。)

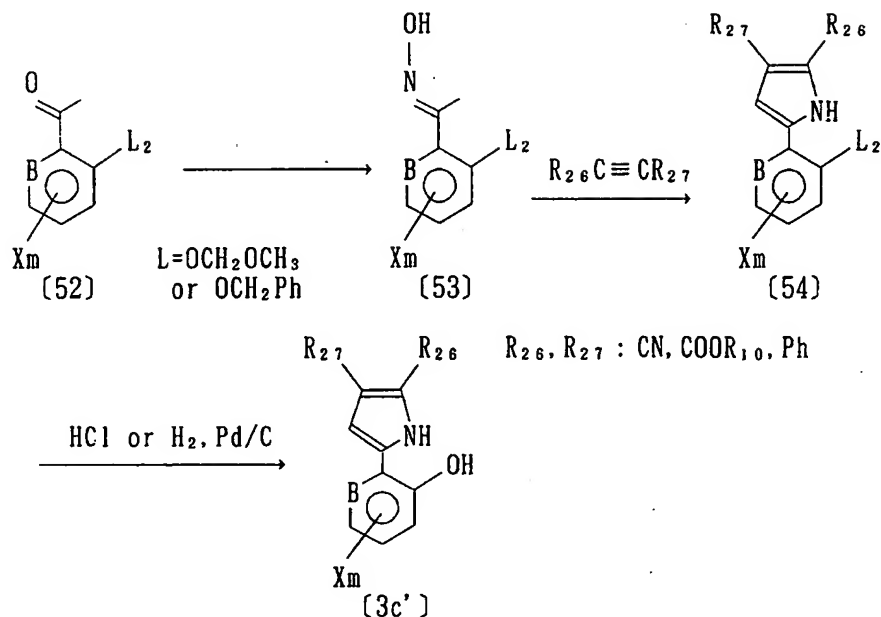


化合物〔50〕と酸クロリドもしくは、酸無水物との反応を行い、〔51〕を得た後に、〔3g〕の製造法と同様の反応を行うことにより、1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イルの誘導体〔3a'〕が製造される。(式中、 L_2 , R_5 , R_7 は前記と同じ意味を表す。)

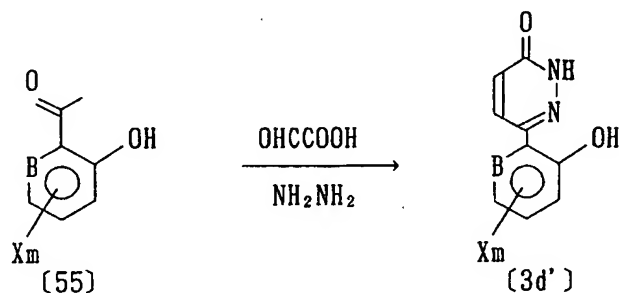


ベンゾフラン〔47〕とヒドラジン類を25～80℃で0.5～8時間反応させることで、ピラゾール-4-イルの誘導体〔3b'〕を製造することが出来る。

(式中、 R_6 は前記と同じ意味を表す。)



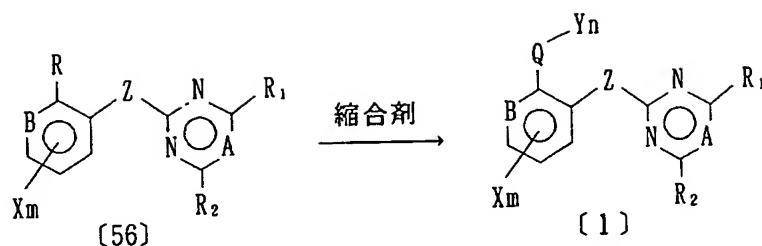
ピロール-3-イルの誘導体〔3c'〕はケトン〔52〕をオキシム〔53〕とした後に、アセチレン化合物との反応で環化させて、ピロール環を形成して〔54〕とした後に〔3g〕の製造法と同様の反応を行うことにより、製造される。(式中 R_{26} 、 R_{27} はCN、 COOR_{10} 、フェニル基を表し、 L_2 、 R_{10} は前記と同じ意味を表す。)



ケトン〔55〕を、グリオキシル酸とヒドラジンと反応させることにより、3-ピリダジノン-6-イルの誘導体〔3d'〕を製造することができる。

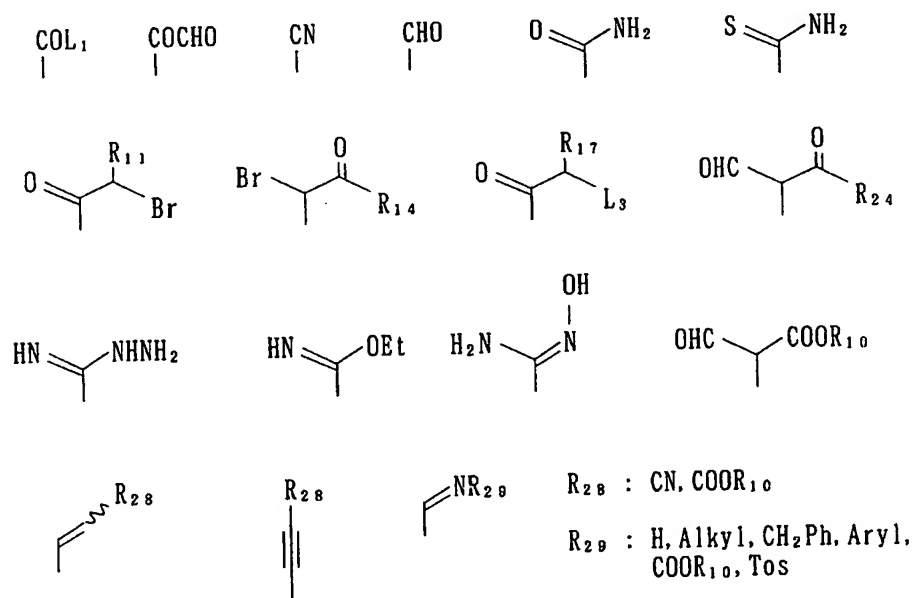
又、次の方法によっても一般式〔1〕で表される化合物は製造することが出来る。

(製造法-2)



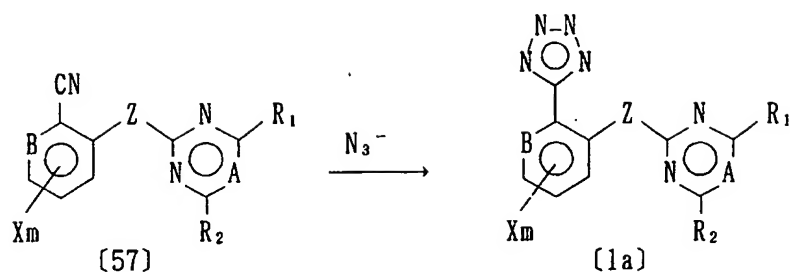
上述の、化合物〔3〕の合成法に準じた方法で製造することが出来る。即ち、一般式〔56〕で示される化合物と、上記〔3〕の製造法で示された、適当な縮合剤を反応させることにより〔1〕を製造する方法である。

但し、置換ピリミジンを含む事で問題がある場合は、この方法は用いられない。(式中、 R_1 , R_2 , A, B, Q, X, Y, Z, m, n は前記の意味を表し、R は



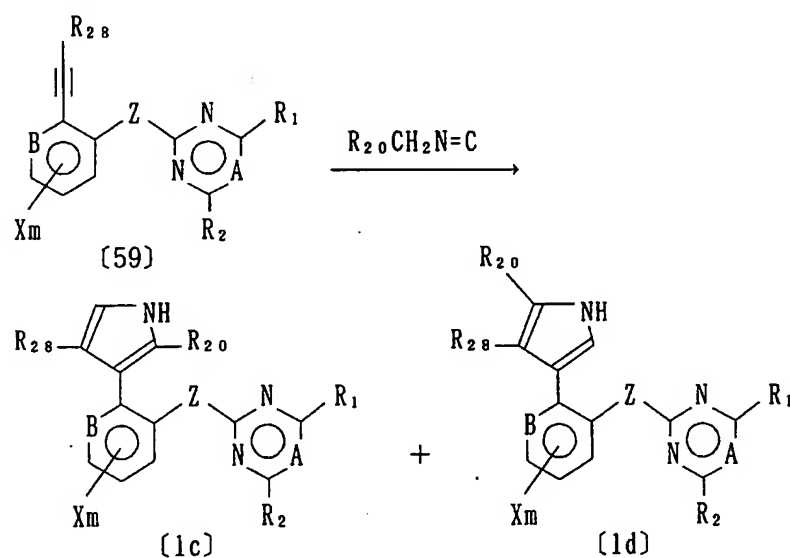
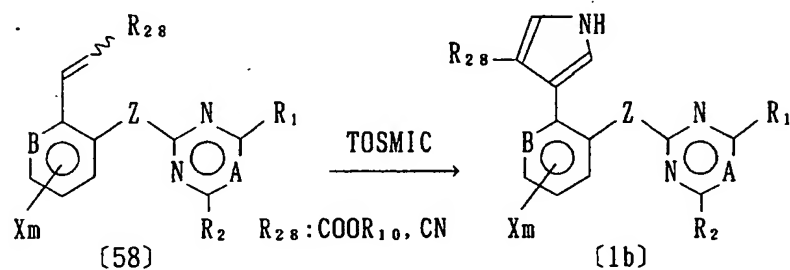
に示した基を表す。 $L_1, L_3, R_{10}, R_{11}, R_{14}, R_{17}, R_{24}$ は前記と同じ意味を表す。)

a) テトラゾール〔1a〕の製造法



一般式〔57〕で示される化合物とアジ化ナトリウムを適当な溶媒中、好ましくはDMFを用い、室温～溶媒の沸点未満の温度、好ましくは80～120℃で1～24時間反応させることにより製造される。(以下、式中、 R_1 , R_2 , A, B, Z, X, mは前記の意味を示す。)

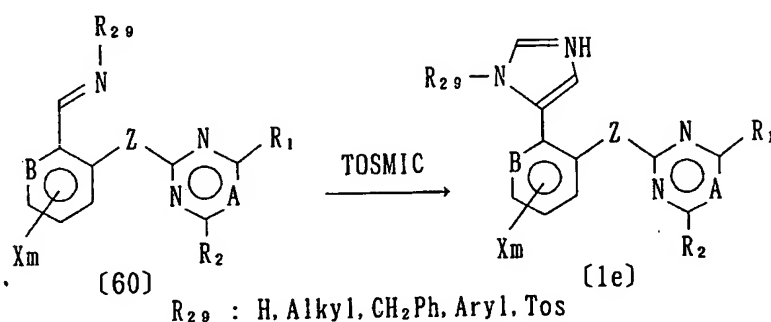
b) ピロール〔1b〕, 〔1c〕, 〔1d〕の製造法



一般式〔58〕、あるいは〔59〕で示される化合物とTosMIC等のイソ

シアニド類を適当な塩基の存在下、適当な溶媒中、室温～溶媒の沸点未満の温度で1～24時間反応させることにより製造される。この反応に用いられる溶媒としては、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、アセトン、MEK等のケトン類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、DMF, DMSO等の非プロトン性極性溶媒、アセトニトリル、水等が挙げられる。又、この反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化金属類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビストリメチルシリルアミド等のリチウムアミド類、トリエチルアミン、DBU等の有機塩基類等が挙げられる。

c) イミダゾール〔1e〕の製造法

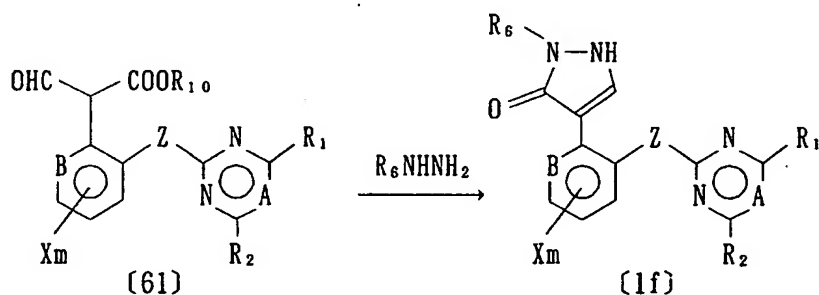


文献公知の方法に従い、一般式〔60〕で示される化合物とTosMICを適当な塩基の存在下、適当な溶媒中、室温～溶媒の沸点未満の温度で1～24時間反応させることにより製造される。

この反応に用いられる溶媒としては、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、アセトン、MEK等のケトン類、酢酸メチル、酢酸エチル

等のエステル類、DMF、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、アセトニトリル、水等が挙げられる。又、この反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化金属類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビストリメチルシリルアミド等のリチウムアミド類、トリエチルアミン、DBU等の有機塩基類等が挙げられる。

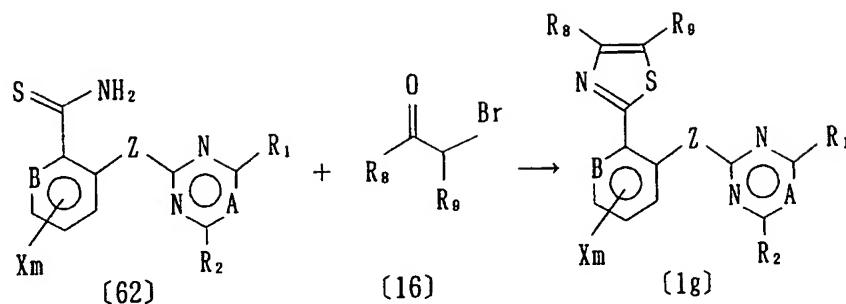
d) ピラズロン〔1f〕の製造法



一般式〔61〕で示される化合物とヒドラジン類を適当な塩基の存在下、若しくは非存在下、適当な溶媒中、室温～溶媒の沸点未満の温度で1～24時間反応させることにより製造される。この反応に用いられる溶媒としては、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、アセトン、MEK等のケトン類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、DMF、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、アセトニトリル、水等が挙げられる。又、この反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化金属類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビストリメチルシリルアミド等のリチウムアミド類、トリエチルアミン、DBU等の有機塩基類等が挙げられる。

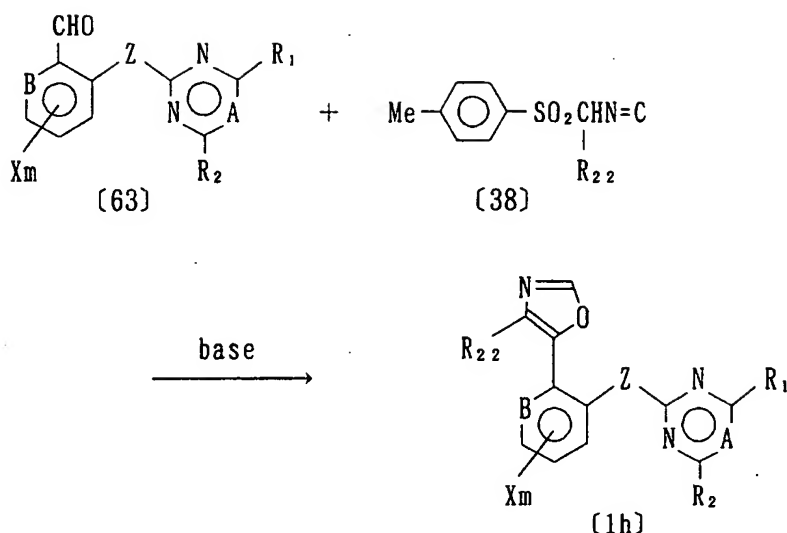
(式中、 R_6 、 R_{10} は前記と同じ意味を表す。)

e) チアゾール〔1g〕の製造法



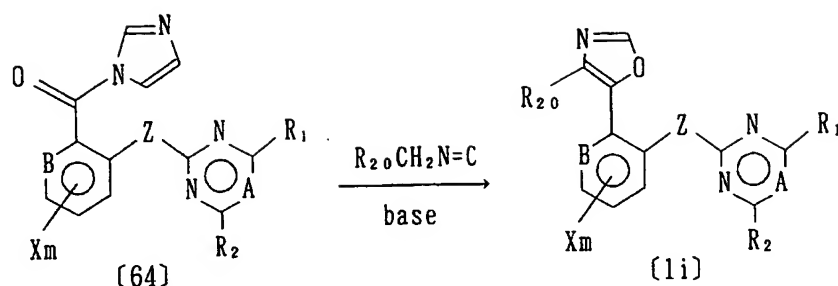
一般式〔62〕で示される化合物とプロモケトン〔16〕を適当な塩基の存在下、若しくは非存在下、適当な溶媒中、室温～溶媒の沸点未満の温度で1～24時間反応させることにより製造される。この反応に用いられる溶媒としては、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、アセトン、MEK等のケトン類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、DMF、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、アセトニトリル等が挙げられる。又、この反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化金属類、リチウムジイソプロピルアミド等のリチウムアミド類、トリエチルアミン、DBU等の有機塩基類等が挙げられる。(式中、R₈、R₉は前記と同じ意味を表す。)

f) オキサゾール〔1h〕の製造法



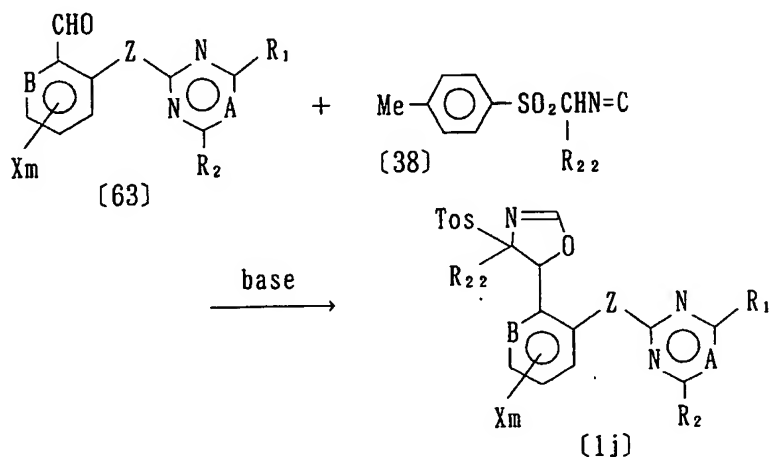
一般式〔63〕で示されるアルデヒドとイソニトリル〔38〕をアルデヒドに対して2等量以上の適当な塩基の存在下、適当な溶媒中、室温～溶媒の沸点未満の温度で1～24時間反応させることにより製造される。この反応に用いられる溶媒としては、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、DMF、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、アセトニトリル等が挙げられる。又、この反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化金属類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビストリメチルシリルアミド等のリチウムアミド類、トリエチルアミン、DBU等の有機塩基類等が挙げられる。(式中、 R_{22} は前記と同じ意味を表す。)

g) オキサゾール〔1i〕の製造法



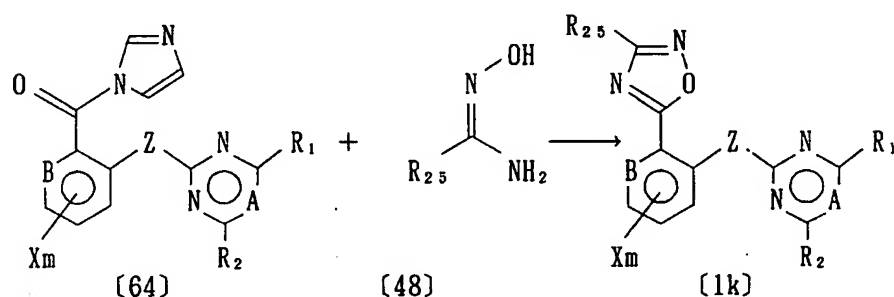
一般式〔64〕で示されるアシルイミダゾールとイソニトリル類を適当な塩基の存在下、適当な溶媒中、 $-78 \sim 80^{\circ}\text{C}$ の温度で1～24時間反応させることにより〔1i〕が製造される。この反応に用いられる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、DMF、DM SO等の非プロトン性極性溶媒、アセトニトリル等が挙げられる。又、この反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化金属類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビストリメチルシリルアミド等のリチウムアミド類、トリエチルアミン、DBU等の有機塩基類等が挙げられる。（式中、 R_{20} は前記と同じ意味を表す。）

h) オキサゾリン〔1j〕の製造法



一般式〔63〕で示されるアルデヒドとイソニトリル〔38〕をアルデヒドに対してはほぼ等量の適当な塩基の存在下、適当な溶媒中、0℃～室温の温度で1～2時間反応させることにより〔1j〕が製造される。この反応に用いられる溶媒としては、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、DMF、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、アセトニトリル等が挙げられる。又、この反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化金属類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビストリメチルシリルアミド等のリチウムアミド類、トリエチルアミン、DBU等の有機塩基類等が挙げられる。（式中、 R_{22} は前記と同じ意味を表す。）

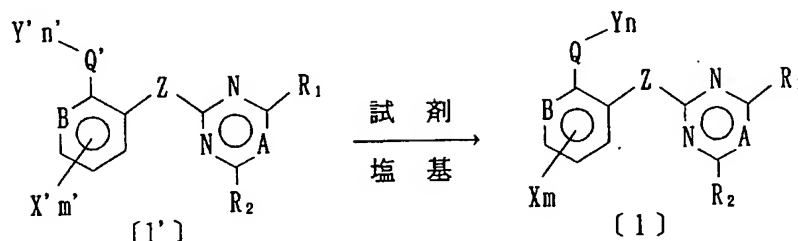
i) オキサジアゾール〔1k〕の製造法



一般式〔64〕で示されるアシルイミダゾールとアミドキシム〔48〕を適当な塩基の存在下、適当な溶媒中、-15～140℃の温度で1～24時間反応させることにより〔1k〕が製造される。この反応に用いられる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、DMF、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、アセトニトリル等が挙げられる。又、この反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化金属類、リチウムジイソプロピルアミド等のリチウム

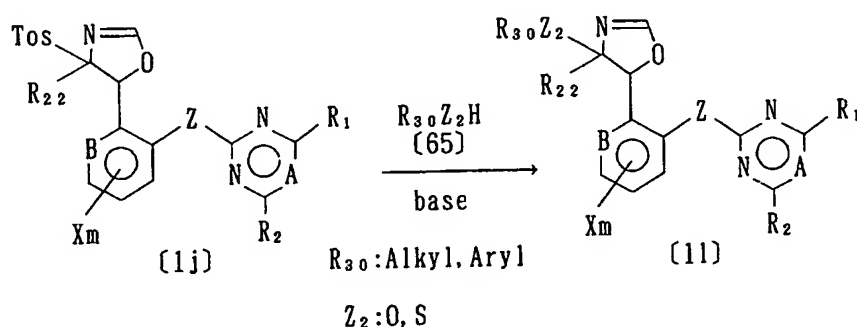
アミド類、トリエチルアミン、DBU等の有機塩基類等が挙げられる。(式中、 R_{25} は前記と同じ意味を表す。)

(製造方法-3)



一般式〔1'〕で示される化合物を、文献公知の方法に従い、適当な塩基、もしくは酸の存在下、無溶媒又は適当な溶媒中、 -78°C ～溶媒の沸点未満の温度で、適当な試剤(例えば、ヨウ化メチル等のアルキル化剤、アセチルクロリドのようなアシル化剤、メタンスルホニルクロリドのようなスルホニル化剤等)と、1～24時間反応させ、ヘテロ環 Q' 上の置換基 $Y'n$ もしくはベンゼン環(ピリジン環)上の置換基 $X'm$ を誘導化して〔1〕を合成する。(但し、式中、 R_1 、 R_2 、 A 、 B 、 Q 、 X 、 Y 、 Z 、 m 、 n は前記と同じ意味を表し、 Q' 、 X' 、 Y' 、 m' 、 n' はそれぞれ Q 、 X 、 Y 、 m 、 n と同意味を示す。)

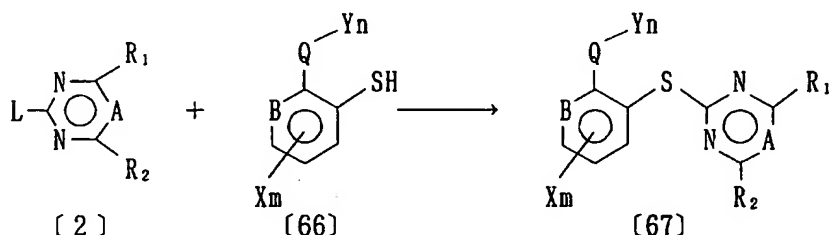
a) オキサゾリン



一般式〔1j〕の化合物と〔65〕を適当な塩基の存在下、適当な溶媒中、 -15 ～ 25°C の温度で1～24時間反応させることにより〔11〕が製造される。この反応に用いられる溶媒としては、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、TH

F等のエーテル類、アセトン、MEK等のケトン類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、DMF、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、アセトニトリル、水等が挙げられる。又、この反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化金属類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビストリメチルシリルアミド等のリチウムアミド類、トリエチルアミン、DBU等の有機塩基類等が挙げられる。(式中、 Z_2 は酸素、硫黄を表し、 R_{30} はアルキル、アリールを表し、 R_{22} は前記と同じ意味を表す。)

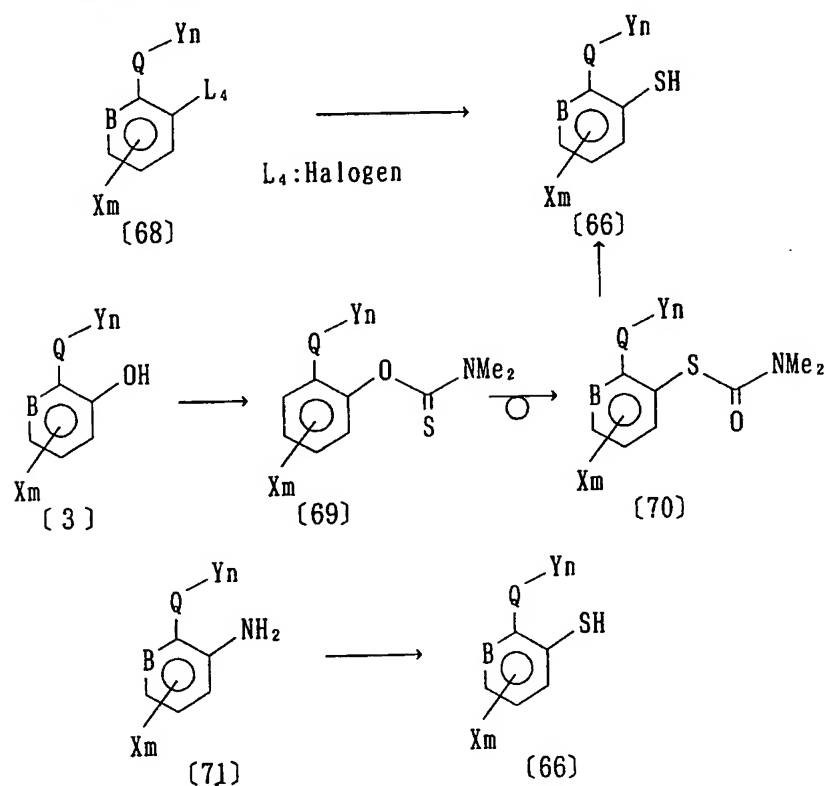
(製造方法-4)



一般式〔2〕(式中、 R_1 、 R_2 、A、Lは前記と同じ意味を表す。)の化合物と、一般式〔66〕(式中、B、Q、X、Y、m、nは前記と同じ意味を表す。)の化合物を、有機溶媒中で塩基の存在下カップリングさせる。塩基としては、水素化ナトリウム等の水素化金属類、炭酸カリウム等の炭酸塩類、トリエチルアミン等の有機塩基類であり、溶媒としては、DMF、DMSO、THF、DME等が挙げられる。反応混合物は反応が完了するまで、0～90℃、場合によっては120℃で攪拌される。

上記の反応における原料のo-ヘテロ環置換チオール(あるいは、メルカプトピリジン)誘導体〔66〕は以下に述べるような方法により製造することができる。尚、特に指定をしていない場合に於いては以下の反応で用いられる溶媒としては、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロ

ゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、アセトン、MEK等のケトン類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、DMF、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、アセトニトリル等のニトリル類、水等が挙げられる。又、用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類、水素化ナトリウム等の水素化金属類、ブチルリチウム等のアルキル金属類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビストリメチルシリルアミド等のリチウムアミド類、トリエチルアミン、DBU等の有機塩基類等が挙げられる。又、用いられる酸としては塩酸、硝酸、硫酸等の鉱酸類、蟻酸、酢酸等の有機酸類、塩化アルミニウム、ボロントリフロリドジエチルエーテル等のルイス酸類が挙げられる。又、反応温度としては、 $-90^{\circ}\text{C} \sim 250^{\circ}\text{C}$ の温度が挙げられる。(以下、式中Q, X, Y, m, n, Bは前記と同じ意味を表す。)

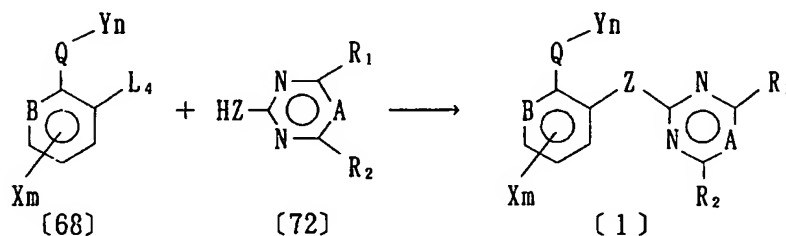


上述の、化合物〔3〕の合成法に準じた方法で製造する事の出来る、一般式〔68〕の化合物に硫化ナトリウムやチオウレア等を反応させて、化合物〔66〕を製造することが出来る。この反応の参考文献としては、Chemistry Letters, 1307ページ(1985年)が挙げられる。

あるいは、〔66〕は、前述の化合物〔3〕を〔69〕に誘導した後、J. Org. Chem. 31巻、3980ページ(1966年)に記載された、ニューマン転位反応により〔70〕として、これを加水分解する事によっても製造することが出来る。

又、アニリン誘導体〔71〕をOrganic Syntheses Collect., 3巻、809ページに記載の方法を応用しても、〔66〕を製造することが出来る。(式中、 L_4 はハロゲン、好ましくはフッ素を表す。)

(製造法-5)



一般式〔72〕(式中、 R_1 , R_2 , A, Zは一前記と同じ意味を表す。)の化合物と、一般式〔68〕(式中、B, Q, X, Y, m, n, L_4 は前記と同じ意味を表す。)の化合物を、有機溶媒中で塩基の存在下カップリングさせる。塩基としては、水素化ナトリウム等の水素化金属類、炭酸カリウム等の炭酸塩類、トリエチルアミン等の有機塩基類であり、溶媒としては、DMF, DMSO, THF, DME等が挙げられる。反応混合物は反応が完了するまで、0~90℃、場合によっては120℃で攪拌される。

一般式〔1〕で表される化合物の塩としては、環境容認性の塩、例えば、塩酸塩、臭化水素塩等の無機酸塩類、酢酸塩、蔞酸塩、蟻酸塩等の有機酸塩類等、及びアルカリ金属、アルカリ土類金属、アンモニウム塩等が挙げられる。これらの塩は慣用の方法で製造し得る。

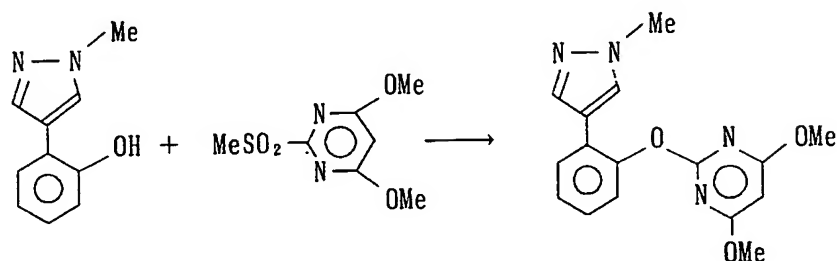
本発明化合物の構造は、IR, NMR, MS等から決定した。

発明を実施するための最良の形態：

次に実施例を挙げ本発明化合物を更に詳細に説明する。

実施例 1

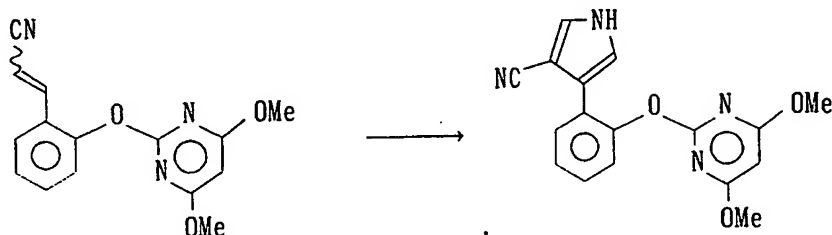
1-メチル-4-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)フェニル)ピラゾール(化合物番号14-13)の合成



2-(1-メチルピラゾール-4-イル)フェノール0.32gをDMF 5mlに溶解し、60%NaH 0.1gを加え、50℃で30分間、攪拌した。次いで、2-メタンスルホニル-4,6-ジメトキシピリミジン0.45gを加え、50℃で30分間攪拌した後、室温で14時間攪拌した。反応終了後、溶媒を減圧下留去し、得られた残査を酢酸エチル-水に溶解し、有機層を水洗、次いで無水硫酸マグネシウムで乾燥した。濾過後、溶媒を減圧下留去し、得られた残査をカラムクロマト(シリカゲル; 溶出溶媒: ヘキサン-アセトン=8-2)で精製し、目的物0.31gを得た。

実施例 2

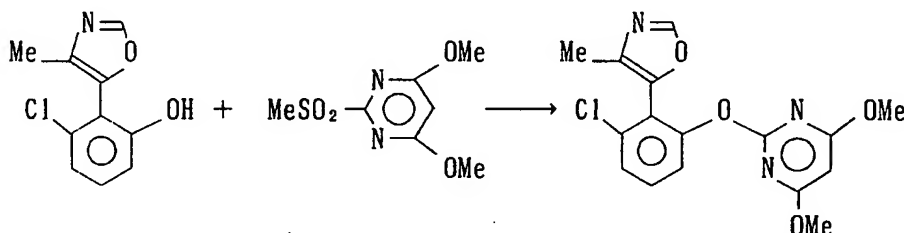
3-シアノ-4-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)フェニル)ピロール(化合物番号17-2)の合成



2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)桂皮ニトリル 1.1 g と TosMIC 0.76 g の THF 10 ml 溶液を、窒素気流中、攪拌下、60% NaH 0.18 g の THF 10 ml 懸濁液に滴下した。室温で1時間攪拌した後、氷水に注入し、次いで酢酸エチルを加え抽出した。有機層を水洗、次いで無水硫酸マグネシウムで乾燥した。濾過後、溶媒を減圧下留去した。得られた残渣をカラムクロマト(シリカゲル; 溶出溶媒: ヘキサン-アセトン=8-2)で精製し、目的物 0.32 g を得た。

実施例 3

4-メチル-5-(2-クロル-6-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)フェニル)オキサゾール(化合物番号13-80)の合成

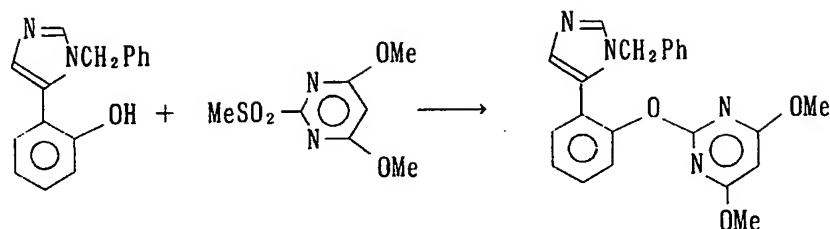


2-(4-メチルオキサゾール-5-イル)-3-クロロフェノール 0.25 g、2-メタンスルホニル-4,6-ジメトキシピリミジン 0.19 g と炭酸カリウム 0.42 g の DMF 5 ml 溶液を 50℃ で 14 時間攪拌した。反応終了後、反応液を氷水に注入し、次いで酢酸エチルを加え抽出した。有機層を水洗、次いで無水硫酸マグネシウムで乾燥した。濾過後、溶媒を減圧下留去し、目的物 0.34 g を得た。

実施例 4

1-ベンジル-5-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)フェニル)イミダゾール(化合物番号2-13)の合成

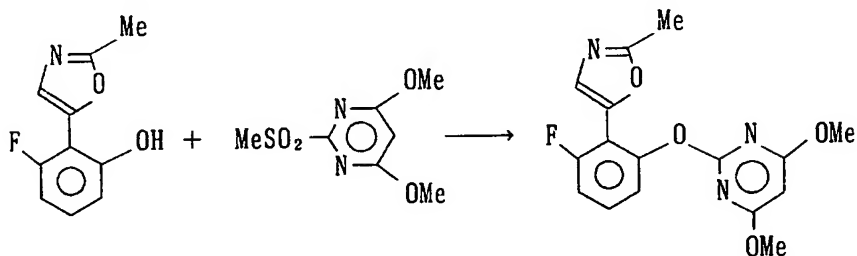
38



2-(1-ベンジルイミダゾール-5-イル)フェノール 2.5 g、2-メタンスルホニル-4,6-ジメトキシピリミジン 2.2 g と炭酸カリウム 2.76 g の DMF 20 ml 溶液を 50℃ で 14 時間攪拌した。反応終了後、反応液を氷水に注入し、次いで酢酸エチルを加え抽出した。有機層を水洗、次いで無水硫酸マグネシウムで乾燥した。濾過後、溶媒を減圧下留去し、得られた残留物をカラムクロマト（シリカゲル；溶出溶媒：塩化メチレン-アセトン＝85-15）で精製し、目的物 2.75 g を得た。

実施例 5

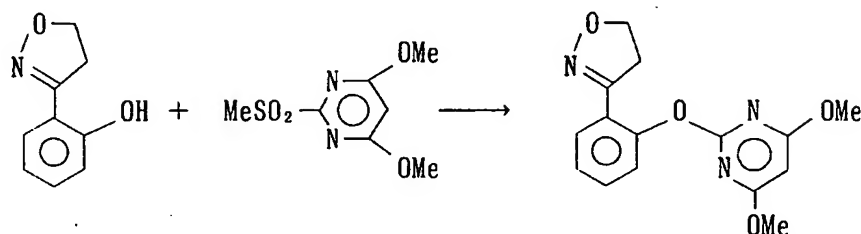
2-メチル-5-(2-フルオロ-6-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)フェニル)オキサゾール（化合物番号 13-102）の合成



2-(2-メチルオキサゾール-5-イル)-3-フルオロフェノール 0.12 g、2-メタンスルホニル-4,6-ジメトキシピリミジン 0.12 g と炭酸カリウム 0.18 g の DMF 4 ml 溶液を 50℃ で 14 時間攪拌した。反応終了後、反応液を氷水に注入し、次いで酢酸エチルを加え抽出した。有機層を水洗、次いで無水硫酸マグネシウムで乾燥した。濾過後、溶媒を減圧下留去し、得られた残渣を石油エーテルで処理し、目的物 0.1 g を得た。

実施例 6

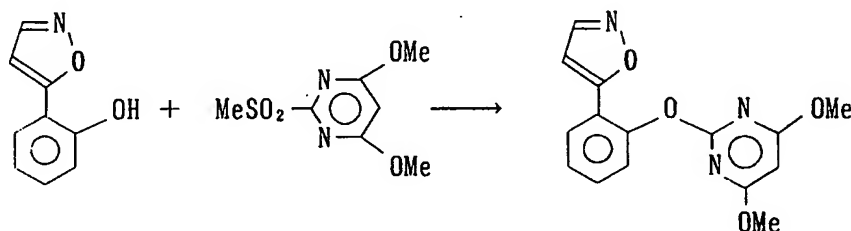
3-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)フェニル)-
2-イソオキサゾリン(化合物番号4-12)の合成



2-(2-イソオキサゾリン-5-イル)フェノール0.6gと4,6-ジメトキシ-2-メタンスルホニルピリミジン0.78gをDMFに溶解し、攪拌下、室温にて60%NaH0.16gを加え、30~40℃で2.5時間攪拌した。反応終了後、反応液を氷水に注入し、濾別した。得られた結晶を酢酸エチルに溶解し、有機層を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧下留去した。得られた結晶をn-ヘキサンで洗浄し、目的物1gを得た。

実施例 7

5-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)フェニル)イ
ソオキサゾール(化合物番号5-12)の合成

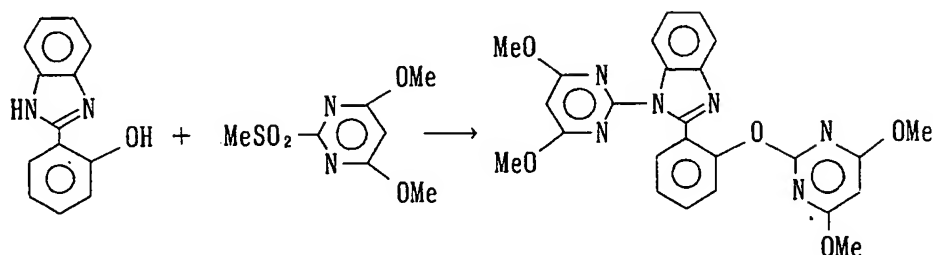


60%NaH0.11gをDMFに懸濁させ、攪拌下、5℃にて2-(イソオキサゾール-5-イル)フェノール0.4gのDMF溶液を滴下した。30~40℃で30分間攪拌し、次いで、4,6-ジメトキシ-2-メタンスルホニルピリミジン0.53gを加え、室温で5時間攪拌した。反応終了後、反応液を氷水に注入し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧下留去した。得られた残査をカラムク

ロマトにて精製し、目的物 0.3 g を得た。

実施例 8

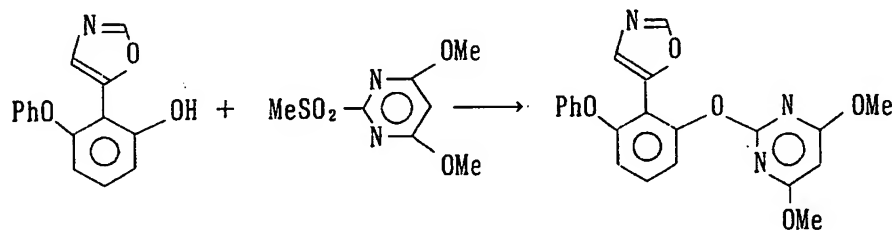
1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-2-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)フェニル)ベンズイミダゾール(化合物番号 1-12)の合成



60% NaH0.21 g を DMF に懸濁させ、攪拌下、室温にて 2-(ベンズイミダゾール-2-イル)フェノール 1 g の DMF 溶液を滴下した。30~40℃で 30 分間攪拌し、次いで、4,6-ジメトキシ-2-メタンスルホニルピリミジン 1.01 g を加え、40℃で 4 時間攪拌した。反応終了後、反応液を氷水に注入し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧下留去した。得られた残渣をカラムクロマトにて精製し、目的物 0.1 g を得た。

実施例 9

5-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)-6-フェノキシ)フェニルオキサゾール(化合物番号 20-22)の合成

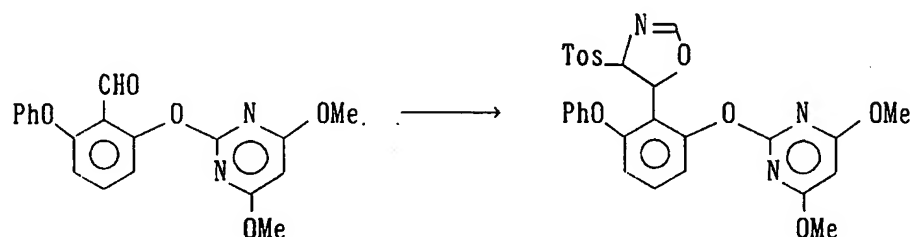


2-(オキサゾール-5-イル)-3-フェノキシフェノール 0.43 g と炭酸カリウム 0.47 g を DMF に懸濁させ、30~40℃で 30 分間攪拌した後、4,6-ジメトキシ-2-メタンスルホニルピリミジン 0.36 g を加え、50

℃で一晩撹拌した。反応終了後、反応液を氷水に注入し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧下留去して、目的物 0.39 g を得た。

実施例 10

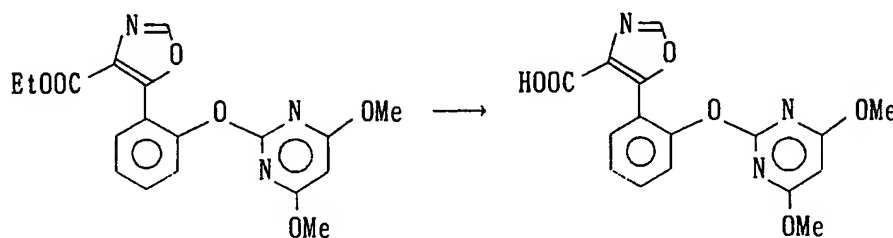
4-(p-トルエンシルホニル)-5-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)-6-フェノキシフェニル)-2-オキサゾリン(化合物番号27-20)の合成



2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)-6-フェノキシベンズアルデヒド 0.47 g と TosMIC 0.26 g をメタノールに懸濁させ、撹拌下、0℃にて炭酸カリウム 0.18 g を加え、同温度で15分撹拌した。反応終了後、反応液を氷水に注入し、濾別した。得られた結晶を酢酸エチルに溶解し、有機層を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧下留去した。得られた残査をベンゼン、石油エーテルの混合溶媒で再結晶させ、目的物 0.5 g を得た。

実施例 11

4-カルボキシル-5-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)フェニル)オキサゾール(化合物番号13-9)の合成

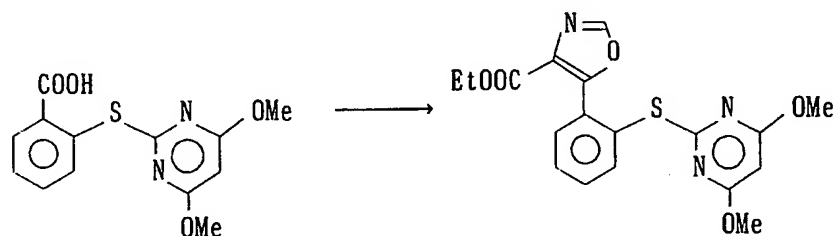


4-エトキシカルボニル-5-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-

イルオキシ) フェニル) オキサゾール 0.69 g を THF に溶解し、攪拌下、 -15°C にて 10% NaOH 水溶液を滴下し、 40°C で 2 時間攪拌した。反応終了後、反応液に 3N-HCl 水溶液を加え、酸性にした後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧下留去した。得られた残査をエーテルで洗浄し、目的物 0.4 g を得た。

実施例 12

4-エトキシカルボニル-5-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルチオ)フェニル)オキサゾール(化合物番号13-160)の合成

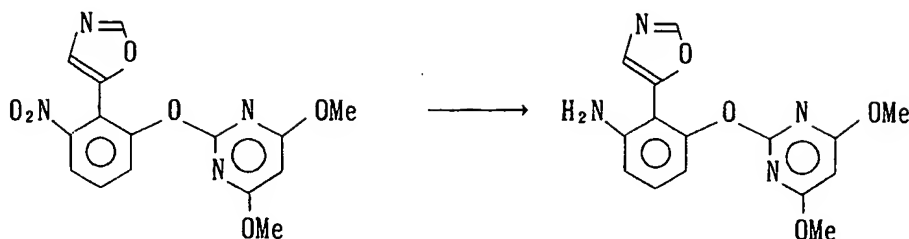


(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルチオ)安息香酸 2 g を THF に溶解し、攪拌下、室温にて N, N'-カルボニルジイミダゾール 1.22 g を加え、 $40\sim 50^{\circ}\text{C}$ で 50 分攪拌した。この反応液を、イソシアノ酢酸エチル 1.55 g の THF 溶液に、攪拌下、 -15°C にて DBU 2 g を滴下した直後、 -5°C にて滴下し、室温で二日間攪拌した。反応終了後、反応液を氷水に注入し、30 分攪拌した後、エーテルと酢酸エチルの混合溶媒で抽出した。有機層を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧下留去した。得られた残査をカラムクロマトにて精製し、目的物 1.36 g を得た。

実施例 13

5-(2-アミノ-6-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)フェニル)オキサゾール(化合物番号13-118)の合成

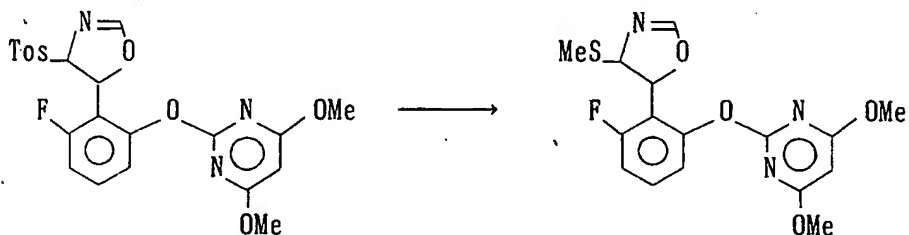
43



鉄粉 0.24 g を 60% 酢酸水 3.2 ml に懸濁させ、攪拌下、50℃にて5-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)-6-ニトロフェニル)オキサゾール 0.6 g の MEK 溶液を滴下し、60~70℃で2時間攪拌した。反応終了後、反応液に酢酸エチルを加え、濾過した。濾液を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧下留去した。得られた残査をカラムクロマトにて精製し、目的物 0.45 g を得た。

実施例 14

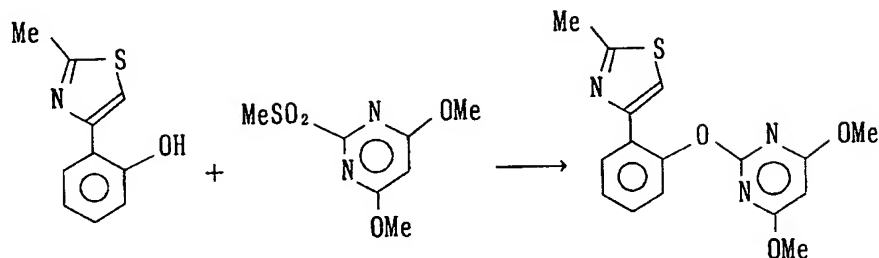
4-メチルチオ-5-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)-6-フルオロフェニル)-2-オキサゾリン (化合物番号 27-14) の合成



4-(p-トルエンシルホニル)-5-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)-6-フルオロフェニル)-2-オキサゾリン 0.57 g の DMF 溶液に、攪拌下、室温にて、15%メチルメルカプタンナトリウム水溶液 1.4 g を滴下し、同温度で20分攪拌した。反応終了後、反応液に氷水を加え、エーテルで抽出した。有機層を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧下留去した。得られた残査をカラムクロマトにて精製し、目的物 0.19 g を得た。

実施例 15

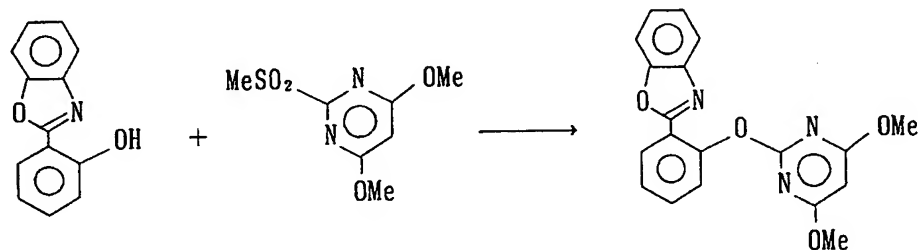
2-メチル-4-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)フェニル)チアゾール(化合物番号21-5)の合成



60%NaH0.09gをDMFに懸濁させ、攪拌下、室温にて、2-(2-メチルチアゾール-4-イル)フェノール0.4gのDMF溶液を滴下した。30~40℃で30分間攪拌し、次いで、4,6-ジメトキシ-2-メタンシルホニルピリミジン0.44gを加え、50℃で一晩攪拌した。反応終了後、反応液を氷水に注入し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧下留去した。得られた残査をカラムクロマトにて精製し、目的物0.34gを得た。

実施例 16

2-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)フェニル)ベンズオキサゾール(化合物番号11-4)の合成

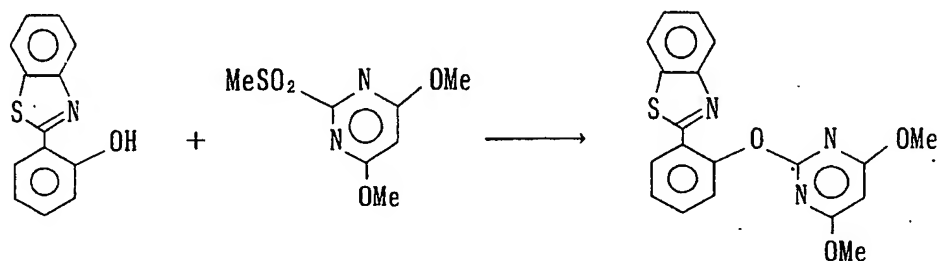


60%NaH0.15gをDMFに懸濁させ、攪拌下、室温にて2-(ベンズオキサゾール-2-イル)フェノール0.7gのDMF溶液を滴下した。30~40℃で30分間攪拌し、次いで、4,6-ジメトキシ-2-メタンシルホニルピリミジン0.7gを加え、50℃で一晩攪拌した。反応終了後、反応液を氷水

に注入し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧下留去した。得られた残査をカラムクロマトにて精製し、目的物0.62gを得た。

実施例 17

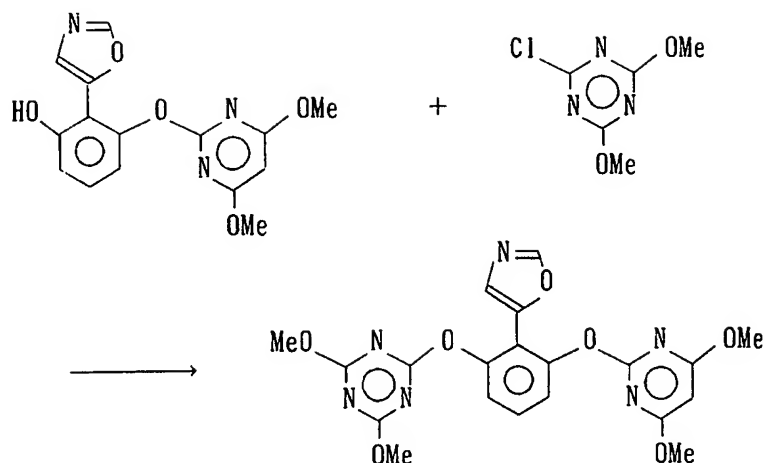
2-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)フェニル)ベンズチアゾール(化合物番号22-4)の合成



60%NaH0.2gをDMFに懸濁させ、攪拌下、室温にて、2-(ベンズチアゾール-2-イル)フェノール1.0gのDMF溶液を滴下した。30~40℃で30分間攪拌し、次いで、4,6-ジメトキシ-2-メタンスルホニルピリミジン0.96gを加え、60℃で5時間、さらに室温で一晩攪拌した。反応終了後、反応液を氷水に注入し、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧下留去した。得られた残査をカラムクロマトにて精製し、目的物1.2gを得た。

実施例 18

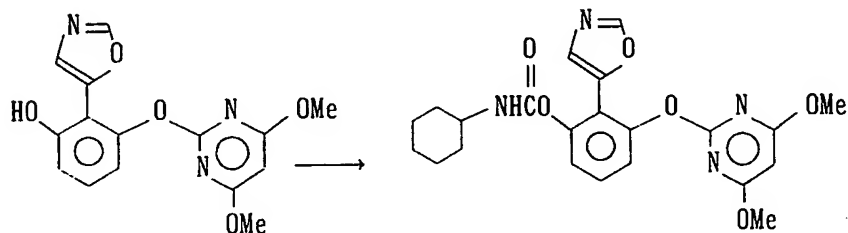
5-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)-6-(4,6-ジメトキシトリアジン-2-イルオキシ)フェニル)オキサゾール(化合物番号10-12)の合成



炭酸カリウム 0.14 g と 5-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)-6-ヒドロキシフェニル)オキサゾール 0.15 g の DMF 溶液に、2-クロロ-4,6-ジメトキシトリアジン 0.13 g の DMF 溶液を一気に加えた。反応液を室温で一晩、攪拌した。反応終了後、反応液を氷水に注入し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧下留去して、目的物 0.22 g を得た。

実施例 19

5-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)-6-(N-シクロヘキシルカルバモイルオキシ)フェニル)オキサゾール (化合物番号 13-132) の合成

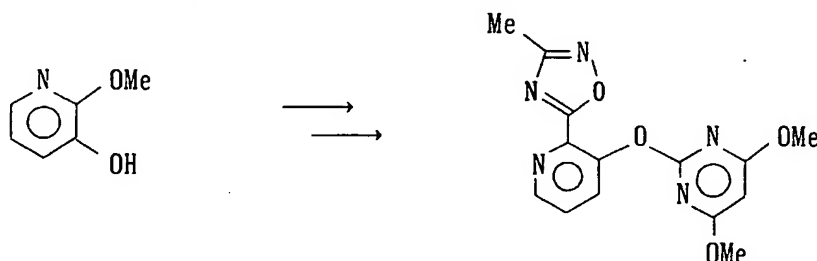


5-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)-6-ヒドロキシフェニル)オキサゾール 0.15 g の塩化メチレン溶液にトリエチルアミン 0.07 g を加えた。反応液を室温で攪拌して、15 分後にシクロヘキシルイソ

シアネート 0.08 g を加えた。さらに、1.5 時間攪拌後、反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧下留去して、得られた油状物を n-ヘキサンとジエチルエーテルの混合溶媒より再結晶して、目的物 0.17 g を得た。

実施例 20

2-(3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)-3-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)ピリジン(化合物番号 26-14)の合成

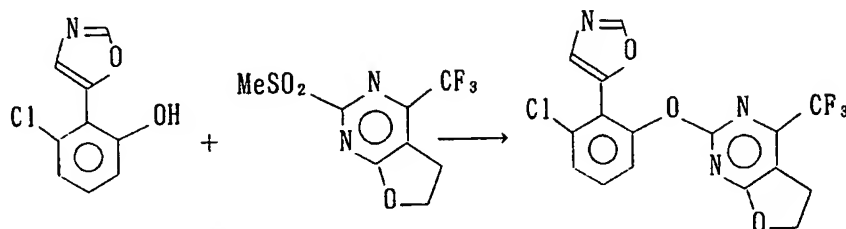


3-ヒドロキシピコリン酸 4.2 g の DMF 溶液に、N, N'-カルボニルジイミダゾール 5.4 g を加えた。発熱、発泡が収まった後に、アセトアミドキシム 2.44 g とトリエチルアミン 3.54 g の DMF 溶液を加えた。反応液を室温で 3 時間攪拌して、さらに 120 °C で 2 時間反応させた。反応終了後、反応液を氷水に注入し、12 N-塩酸で pH を 7~8 に調整して、酢酸エチルで抽出した。有機層を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧下留去して、1.9 g の 2-(3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)-3-ヒドロキシピリジンを得た。

上記ヒドロキシピリジン 1 g と炭酸カリウム 1.55 g の DMF 溶液に、4,6-ジメトキシ-2-メタンスルホニルピリミジン 1.23 g を加え、50 °C で 2 日間攪拌した。反応溶液に水を加え、析出した結晶をろ過した。結晶を酢酸エチルに溶かして、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧下留去して、目的物 1.2 g を得た。

実施例 21

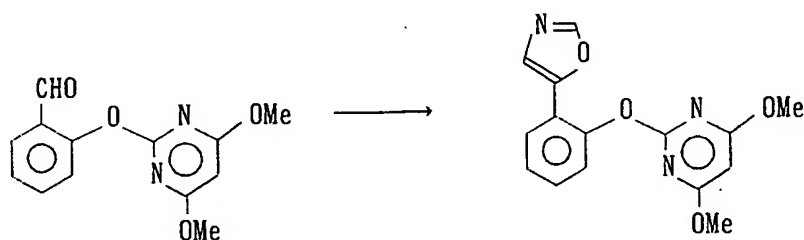
5-(2-クロロ-6-(4-トリフロロメチル-5,6-ジヒドロフロ〔2,3d〕ピリミジン-2-イルオキシ)フェニル)オキサゾール(化合物番号13-89)の合成



2-(オキサゾール-5-イル)-3-クロロフェノール0.2gと炭酸カリウム0.41gをDMFに懸濁させ、30~40℃で30分間攪拌した後、2-メタンスルホニル-4-トリフロロメチル-5,6-ジヒドロフロ〔2,3d〕ピリミジン0.29gを加え、50℃で一晩攪拌した。反応終了後、反応液を氷水に注入し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧下留去して、目的物0.29gを得た。

実施例 22

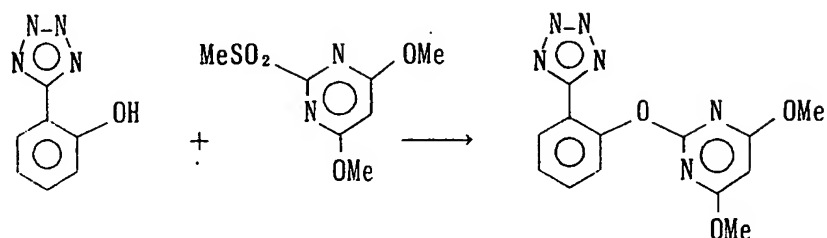
5-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)フェニル)オキサゾール(化合物番号13-1)の合成



2-(2-ホルミルフェノキシ)-4,6-ジメトキシピリミジン0.52gとp-トルエンスルホニルメチルイソシアニド0.49g及び0.69gの炭酸カリウムを10mlのメタノール中15分間攪拌還流した。反応液に氷を加え、析出した固体をろ過した。固体を酢酸エチルに溶解し無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧下留去して、目的物0.54gを得た。

実施例 23

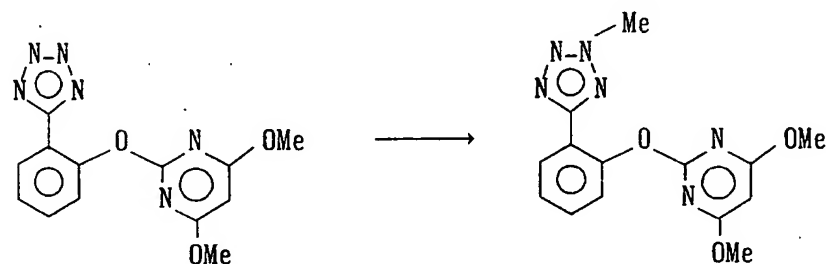
5-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)フェニル)テトラゾール(化合物番号18-1)の合成



2-(テトラゾール-5-イル)フェノール1.62gのDMF溶液を、0.88gの60%NaHのDMF懸濁液に加えた。60℃で40分後に2.4gの4,6-ジメトキシ-2-メタンスルホニルピリミジンを加え、さらに1時間反応させた。反応液を氷にあけて、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧下で留去して、目的物2.5gを得た。

実施例 24

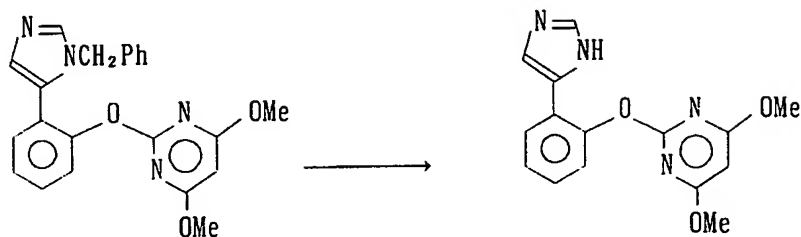
2-メチル-5-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)フェニル)テトラゾール(化合物番号19-2)の合成



5-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)フェニル)テトラゾール1.0gをDMF15mlに溶解した。60%NaH0.15gを加え、5分後にヨウ化メチル1.08gを加えた。室温で3時間反応させた後、反応液に水を加えた。酢酸エチルで抽出して、無水硫酸マグネシウムで乾燥後溶媒を留去して、得られた固体をヘキサン/エーテルより再結晶して、目的物0.32gを得た。

実施例 25

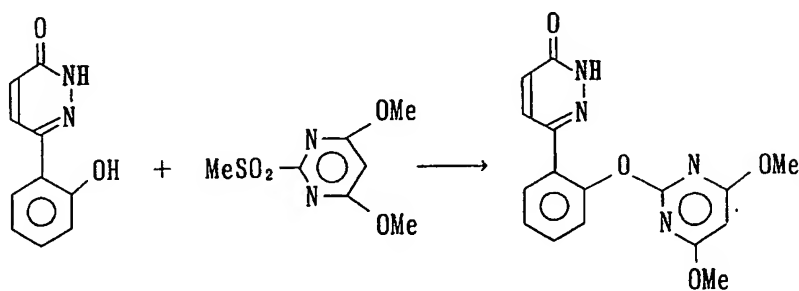
4-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)フェニル)イミダゾール(化合物番号2-1)の合成



1-ベンジル-5-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)フェニル)イミダゾール2gをエタノール20mlに溶解し、パラジウム黒0.5g及び1,4-シクロヘキサジエン4.1gを加え、窒素雰囲気下、10時間加熱還流した。反応終了後、不溶物を濾別し、溶媒を減圧下留去した。得られた残査をカラムクロマト(シリカゲル; 溶出溶媒: 塩化メチレン-アセトン=9:1)で精製し、目的物0.8gを得た。

実施例 26

2H-6-(2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)フェニル)ピリダジン-3-オン(化合物番号26-24)の合成

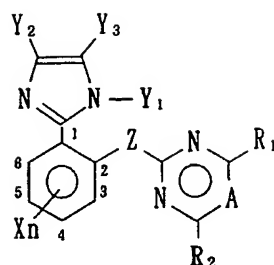


2-(2H-ピリダジン-3-オン-6-イル)フェノール0.5gのDMF溶液20mlに、60%NaH0.11gを加え、50℃で30分間、撹拌した。次いで、2-メタンスルホニル-4,6-ジメトキシピリミジン1.16gを加え、室温で14時間撹拌した後、60℃で5時間撹拌した。反応終了後、溶媒を減圧下留去し、得られた残査を酢酸エチル-水に溶解し、有機層を水洗、次いで

無水硫酸マグネシウムで乾燥した。濾過後、溶媒を減圧下留去し、得られた残査をカラムクロマト（シリカゲル；溶出溶媒：塩化メチレンーアセトン＝9：1）で精製し、目的物0.3gを得た。

上記実施例を含め、本発明化合物の代表例を以下表1～表30に示す。

第 1 表



No.	Xn**	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₁	Y ₃	Y ₂	A	Z	物性値
1-1	H	OMe	OMe	H	H	H	H	CR ₃	O	
1-2	6-F	OMe	OMe	H	H	H	H	CR ₃	O	
1-3	6-Cl	OMe	OMe	H	H	H	H	CR ₃	O	
1-4	H	OMe	OMe	H	Me	H	H	CR ₃	O	1.558
1-5	6-Cl	OMe	OMe	H	Me	H	H	CR ₃	O	
1-6	H	OMe	OMe	H	H	Me	H	CR ₃	O	
1-7	6-Cl	OMe	OMe	H	H	Me	H	CR ₃	O	
1-8	H	OMe	OMe	H	CH ₂ COOH	H	H	CR ₃	O	
1-9	6-Cl	OMe	OMe	H	CH ₂ COOH	H	H	CR ₃	O	
1-10	H	OMe	OMe	H	CH ₂ COOMe	H	H	CR ₃	O	
1-11	6-Cl	OMe	OMe	H	CH ₂ COOMe	H	H	CR ₃	O	
1-12	H	OMe	OMe	H	Py*	-(CH) ₄ -		CR ₃	O	158-160

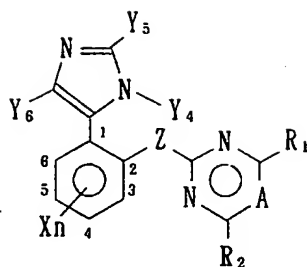
物性値は融点 (**-**)、もしくは 25℃での屈折率 (*, ***)。

* Py は 4, 6-ジメトキシ-2-ピリミジルを表す。

** H はすべて Hであることを表す。指定してある場合は、その他の原子は Hであることを表す。(以下第 2 表以降においても同じ。)

53

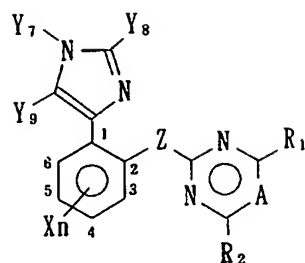
第 2 表



No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₄	Y ₅	Y ₆	A	Z	物性値
2-1	H	OMe	OMe	H	H	H	H	CR ₃	O	180-181
2-2	6-F	OMe	OMe	H	H	H	H	CR ₃	O	
2-3	6-Cl	OMe	OMe	H	H	H	H	CR ₃	O	
2-4	H	OMe	OMe	H	Me	H	H	CR ₃	O	
2-5	6-Cl	OMe	OMe	H	Me	H	H	CR ₃	O	
2-6	H	OMe	OMe	H	H	Me	H	CR ₃	O	
2-7	6-Cl	OMe	OMe	H	CH ₂ Ph	H	H	CR ₃	O	
2-8	H	OMe	OMe	H	H	Ph	H	CR ₃	O	
2-9	6-Cl	OMe	OMe	H	CH ₂ COOH	H	H	CR ₃	O	
2-10	H	OMe	OMe	H	CH ₂ COOH	H	H	CR ₃	O	
2-11	6-Cl	OMe	OMe	H	CH ₂ COOMe	H	H	CR ₃	O	
2-12	H	OMe	OMe	H	CH ₂ COOMe	H	H	CR ₃	O	
2-13	H	OMe	OMe	H	CH ₂ Ph	H	H	CR ₃	O	1.599
2-14	H	OMe	OMe	H	Tos	H	H	CR ₃	O	
2-15	H	OMe	OMe	H	Ac	H	H	CR ₃	O	

5 4

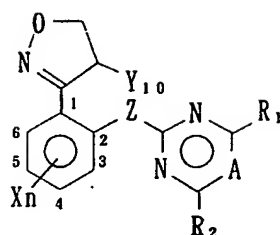
第 3 表



No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₇	Y ₈	Y ₉	A	Z	物性値
3-1	H	OMe	OMe	H	Me	H	H	CR ₃	O	
3-2	6-Cl	OMe	OMe	H	Me	H	H	CR ₃	O	
3-3	6-F	OMe	OMe	H	Me	H	H	CR ₃	O	
3-4	H	OMe	OMe	H	CH ₂ Ph-Cl-4	H	H	CR ₃	O	
3-5	6-Cl	OMe	OMe	H	CH ₂ Ph-Cl-4	H	H	CR ₃	O	
3-6	6-F	OMe	OMe	H	CH ₂ Ph-Cl-4	H	H	CR ₃	O	
3-7	H	OMe	OMe	H	CH ₂ COOH	H	H	CR ₃	O	
3-8	6-Cl	OMe	OMe	H	CH ₂ COOH	H	H	CR ₃	O	
3-9	6-F	OMe	OMe	H	CH ₂ COOH	H	H	CR ₃	O	
3-10	H	OMe	OMe	H	CH ₂ COOMe	H	H	CR ₃	O	
3-11	6-Cl	OMe	OMe	H	CH ₂ COOMe	H	H	CR ₃	O	
3-12	6-F	OMe	OMe	H	CH ₂ COOMe	H	H	CR ₃	O	
3-13	H	OMe	OMe	H	CH ₂ Ph	H	H	CR ₃	O	
3-14	6-Cl	OMe	OMe	H	CH ₂ Ph	H	H	CR ₃	O	
3-15	6-F	OMe	OMe	H	CH ₂ Ph	H	H	CR ₃	O	

5 5

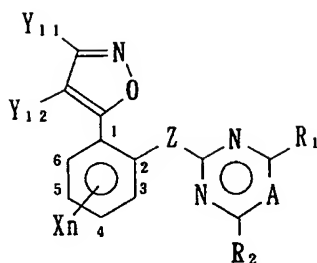
第 4 表



No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₁₀	A	Z	物性値
4-1	6-Br	OMe	OMe	H	H	CR ₃	0	
4-2	6-Cl	OMe	OMe	H	H	CR ₃	0	
4-3	6-F	OMe	OMe	H	H	CR ₃	0	
4-4	6-I	OMe	OMe	H	H	CR ₃	0	
4-5	6-OPh	OMe	OMe	H	H	CR ₃	0	
4-6	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	CR ₃	0	
4-7	H	OMe	CF ₃	H	H	CR ₃	0	
4-8	H	OMe	Me	H	H	CR ₃	0	
4-9	H	Me	Me	H	H	CR ₃	0	
4-10	H	OMe	NHMe	H	H	CR ₃	0	
4-11	H	OMe	NMe ₂	H	H	CR ₃	0	
4-12	H	OMe	OMe	H	H	CR ₃	0	115-117
4-13	H	OMe	OPr-i	H	H	CR ₃	0	
4-14	H	OMe	SMe	H	H	CR ₃	0	
4-15	H	Me	SMe	H	H	CR ₃	0	
4-16	H	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	0	
4-17	6-Cl	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	0	
4-18	6-F	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	0	
4-19	6-OPh	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	0	
4-20	H	OMe	OMe	H	Ph	CR ₃	0	
4-21	6-Cl	OMe	OMe	H	Ph	CR ₃	0	
4-22	6-F	OMe	OMe	H	Ph	CR ₃	0	
4-23	H	OMe	OMe	H	COOH	CR ₃	0	
4-24	H	OMe	OMe	H	COOMe	CR ₃	0	
4-25	6-Cl	OMe	OMe	H	COOMe	CR ₃	0	
4-26	6-F	OMe	OMe	H	COOMe	CR ₃	0	

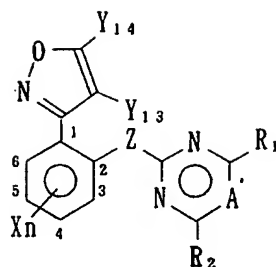
56

第 5 表



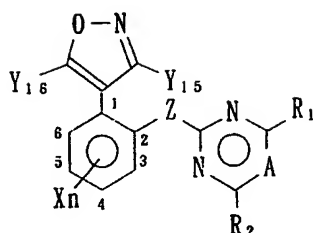
No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₁₁	Y ₁₂	A	Z	物性値
5-1	6-Br	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	O	
5-2	6-Cl	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	O	
5-3	6-F	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	O	
5-4	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		COOH	H	CR ₃	O	
5-5	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		COOMe	H	CR ₃	O	
5-6	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	H	CR ₃	O	
5-7	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		Me	H	CR ₃	O	
5-8	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		Ph	H	CR ₃	O	
5-9	H	OMe	OMe	H	COOH	H	CR ₃	O	
5-10	H	OMe	OMe	H	COOMe	H	CR ₃	O	
5-11	H	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	O	
5-12	H	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	O	Gum
5-13	H	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	O	
5-14	H	OMe	OMe	H	Me	H	CR ₃	O	
5-15	H	OMe	OMe	H	Ph	H	CR ₃	O	
5-16	6-I	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	O	
5-17	6-OMe	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	O	

第 6 表



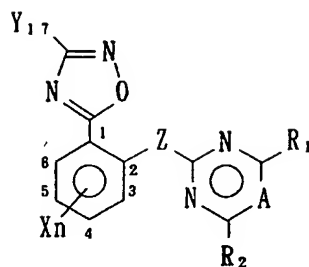
No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₁₃	Y ₁₄	A	Z	物性値
6-1	H	OMe	OMe	H	H	COOH	CR ₃	0	Gum
6-2	H	OMe	OMe	H	H	COOMe	CR ₃	0	
6-3	H	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	0	
6-4	H	OMe	OMe	H	H	Me	CR ₃	0	
6-5	H	OMe	OMe	H	H	Ph	CR ₃	0	
6-6	6-F	CF ₃	-OCH ₂ CH ₂ -		H	H	CR ₃	0	
6-7	6-Cl	CF ₃	-OCH ₂ CH ₂ -		H	H	CR ₃	0	
6-8	6-Br	CF ₃	-OCH ₂ CH ₂ -		H	H	CR ₃	0	
6-9	6-I	CF ₃	-OCH ₂ CH ₂ -		H	H	CR ₃	0	
6-10	6-F	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	0	
6-11	6-Cl	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	0	
6-12	6-Br	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	0	
6-13	6-I	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	0	
6-14	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	COOH	CR ₃	0	
6-15	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	COOMe	CR ₃	0	
6-16	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	H	CR ₃	0	
6-17	H	CF ₃	-OCH ₂ CH ₂ -		H	H	CR ₃	0	
6-18	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	Me	CR ₃	0	
6-19	H	OMe	OMe	H	H	Me	CR ₃	0	
6-20	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	Ph	CR ₃	0	

第 7 表



No.	X _n	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₁₅	Y ₁₆	A	Z	物性値
7-1	6-Cl	CF ₃	-OCH ₂ CH ₂ -		H	H	CR ₃	O	
7-2	6-Cl	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	Me	CR ₃	O	
7-3	6-Cl	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	O	
7-4	6-Cl	OMe	OMe	H	H	Me	CR ₃	O	
7-5	6-F	CF ₃	-OCH ₂ CH ₂ -		H	H	CR ₃	O	
7-6	6-F	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	Me	CR ₃	O	
7-7	6-F	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	Ph	CR ₃	O	
7-8	6-F	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	O	
7-9	6-F	OMe	OMe	H	H	Me	CR ₃	O	
7-10	H	CF ₃	-OCH ₂ CH ₂ -		H	H	CR ₃	O	
7-11	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	Me	CR ₃	O	
7-12	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	Ph	CR ₃	O	
7-13	H	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	O	
7-14	H	OMe	OMe	H	H	Me	CR ₃	O	
7-15	H	OMe	OMe	H	H	Ph	CR ₃	O	

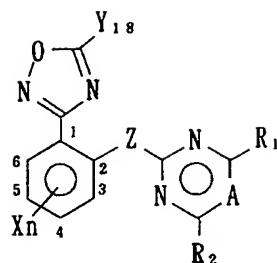
第 8 表



No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₁₇	A	Z	物性値
8-1	H	OMe	OMe	H	H	CR ₃	O	
8-2	6-F	OMe	OMe	H	H	CR ₃	O	
8-3	6-Cl	OMe	OMe	H	H	CR ₃	O	
8-4	H	OMe	OMe	H	H	CR ₃	S	
8-5	6-Cl	OMe	OMe	H	H	CR ₃	S	
8-6	H	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	O	116-120
8-7	6-Cl	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	S	
8-8	6-F	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	O	
8-9	6-OMe	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	O	
8-10	H	OMe	OMe	H	4-Br-Ph	CR ₃	O	118-120
8-11	H	OMe	OMe	H	4-MeO-Ph	CR ₃	O	108-110
8-12	H	OMe	OMe	H	Ph	CR ₃	O	80-81
8-13	H	OMe	OMe	H	COOEt	CR ₃	O	112-114
8-14	H	OMe	OMe	H	COOH	CR ₃	O	
8-15	6-Cl	OMe	OMe	H	COOEt	CR ₃	S	
8-16	6-Cl	OMe	OMe	H	COOH	CR ₃	S	
8-17	H	OMe	OMe	H	Me	N	O	
8-18	H	OMe	OMe	H	Me	N	S	
8-19	6-Cl	OMe	OMe	H	Me	N	O	113-115
8-20	6-Cl	OMe	OMe	H	Me	N	S	
8-21	H	OMe	OMe	H	H	N	O	
8-22	H	OMe	OMe	H	H	N	S	
8-23	6-Cl	OMe	OMe	H	H	N	O	
8-24	6-Cl	OMe	OMe	H	H	N	S	
8-25	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	CR ₃	O	
8-26	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		Me	CR ₃	O	
8-27	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		3-NO ₂ -Ph	CR ₃	O	
8-28	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	CR ₃	S	
8-29	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		Me	CR ₃	S	
8-30	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		3-NO ₂ -Ph	CR ₃	S	
8-31	6-Cl	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	CR ₃	S	
8-32	6-Cl	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		Me	CR ₃	O	
8-33	6-Cl	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		3-NO ₂ -Ph	CR ₃	S	
8-34	H	OMe	OMe	H	CH ₂ SMe	CR ₃	O	64-65
8-35	H	OMe	OMe	H	CH ₂ SO ₂ Me	CR ₃	O	160-162
8-36	6-Br	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	O	
8-37	6-I	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	O	
8-38	6-OPh	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	O	

60

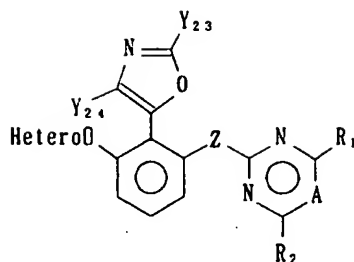
第 9 表



No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₁₈	A	Z	物性値
9-1	H	OMe	OMe	H	H	CR ₃	O	
9-2	6-F	OMe	OMe	H	H	CR ₃	O	
9-3	6-Cl	OMe	OMe	H	H	CR ₃	O	
9-4	H	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	O	
9-5	6-F	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	O	
9-6	6-Cl	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	O	
9-7	H	OMe	OMe	H	Ph	CR ₃	O	
9-8	6-Cl	OMe	OMe	H	Ph	CR ₃	O	
9-9	H	OMe	OMe	H	2,4-Cl ₂ -Ph	CR ₃	O	
9-10	H	OMe	OMe	H	H	CR ₃	S	
9-11	6-Cl	OMe	OMe	H	H	CR ₃	S	
9-12	H	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	S	
9-13	6-Cl	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	S	
9-14	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	CR ₃	O	
9-15	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		Me	CR ₃	O	
9-16	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		3-NO ₂ -Ph	CR ₃	O	
9-17	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	CR ₃	S	
9-18	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		Me	CR ₃	S	
9-19	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		3-NO ₂ -Ph	CR ₃	S	
9-20	6-Cl	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	CR ₃	S	
9-21	6-Cl	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		Me	CR ₃	O	
9-22	6-Cl	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		3-NO ₂ -Ph	CR ₃	S	
9-23	6-Cl	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		4-MeO-Ph	CR ₃	O	
9-24	6-Cl	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		4-MeS-Ph	CR ₃	O	
9-25	6-F	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	O	106
9-26	6-F	OMe	OMe	H	CF ₃	CR ₃	O	
9-27	6-Br	OMe	OMe	H	CF ₃	CR ₃	O	
9-28	6-I	OMe	OMe	H	CF ₃	CR ₃	O	

61

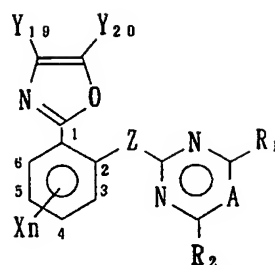
第 10 表



No	Hetero	R ₁	R ₂	R ₃	A	Y ₂₄	Y ₂₃	Z	物性値
10-1	2-methanesulfonyl-6-methoxy-4-pyrimidyl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	
10-2	2-pyridyl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	
10-3	2-pyrimidyl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	
10-4	3,5-dichloro-2-pyridyl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	
10-5	3-chloro-5-trifluoromethyl-2-pyridyl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	Gum
10-6	3-pyridyl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	103-105
10-7	4,6-dimethoxy-2-pyrimidyl	OMe	OMe	H	CR ₃	Bn	H	O	
10-8	4,6-dimethoxy-2-pyrimidyl	OMe	OMe	H	CR ₃	Et	H	O	
10-9	4,6-dimethoxy-2-pyrimidyl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	
10-10	4,6-dimethoxy-2-pyrimidyl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	Me	O	Gum
10-11	4,6-dimethoxy-2-pyrimidyl	OMe	OMe	H	CR ₃	Me	H	O	120-122
10-12	4,6-dimethoxy-2-triazyl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	Gum
10-13	4,6-dimethoxy-2-triazyl	OMe	OMe		N	H	H	O	
10-14	4,6-dimethyl-2-pyrimidyl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	Gum
10-15	4-chloro-6-methyl-2-pyrimidyl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	
10-16	4-methoxy-6-methyl-2-pyrimidyl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	142-143
10-17	4-methoxy-6-methyl-2-pyrimidyl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	Me	O	
10-18	4-methoxy-6-methyl-2-pyrimidyl	OMe	OMe	H	CR ₃	Me	H	O	
10-19	4-pyridyl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	
10-20	6-chloro-2-pyridyl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	
10-21	6-trifluoromethyl-2-pyridyl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	

6 2

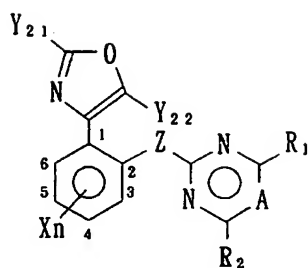
第 11 表



No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₁₉	Y ₂₀	A	Z	物性値
11-1	H	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	0	
11-2	6-F	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	0	
11-3	6-Cl	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	0	
11-4	H	OMe	OMe	H	-(CH) ₄ -		CR ₃	0	88-90
11-5	H	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	S	
11-6	H	OMe	OMe	H	H	Me	CR ₃	0	
11-7	H	OMe	OMe	H	H	Ph	CR ₃	0	
11-8	6-F	OMe	OMe	H	CF ₃	H	CR ₃	0	
11-9	H	OMe	OMe	H	Me	H	CR ₃	0	1.528
11-10	H	OMe	OMe	H	Et	H	CR ₃	0	
11-11	H	OMe	OMe	H	Ph	H	CR ₃	0	
11-12	6-F	OMe	OMe	H	Me	Me	CR ₃	0	
11-13	H	OMe	OMe	H	Me	Me	CR ₃	0	
11-14	H	OMe	OMe	H	Et	Me	CR ₃	0	
11-15	H	OMe	OMe	H	Ph	Me	CR ₃	0	
11-16	6-Cl	OMe	OMe	H	Me	Me	CR ₃	0	
11-17	6-Br	OMe	OMe	H	Me	Me	CR ₃	0	
11-18	6-I	OMe	OMe	H	Me	Me	CR ₃	0	

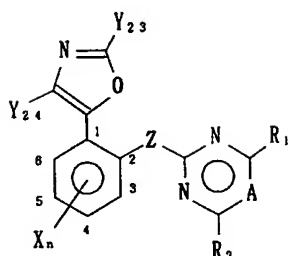
6 3

第 12 表



No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₂₁	Y ₂₂	A	Z	物性値
12-1	6-F	OMe	OMe	H	Me	COOH	CR ₃	O	
12-2	6-F	OMe	OMe	H	Me	COOMe	CR ₃	O	
12-3	6-F	OMe	OMe	H	Me	Et	CR ₃	O	
12-4	6-Cl	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	S	
12-5	6-F	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	O	
12-6	H	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	O	
12-7	H	OMe	OMe	H	Me	H	CR ₃	O	
12-8	6-Cl	OMe	OMe	H	Ph	H	CR ₃	O	
12-9	6-F	OMe	OMe	H	Ph	H	CR ₃	O	1.594
12-10	6-I	OMe	OMe	H	Ph	H	CR ₃	O	
12-11	6-F	OMe	OMe	H	Me	Me	CR ₃	O	
12-12	6-F	OMe	OMe	H	Me	Ph	CR ₃	O	
12-13	H	OMe	OMe	H	Me	Me	CR ₃	O	
12-14	6-Cl	OMe	OMe	H	Me	Me	CR ₃	O	
12-15	H	OMe	OMe	H	Ph	Me	CR ₃	O	

第 13 表



No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	A	Y ₂₃	Y ₂₄	Z	物性値
13-1	H	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	65-67
13-2	H	Cl	Cl	H	CR ₃	H	H	O	
13-3	H	OCF ₂ H	OCF ₂ H	H	CR ₃	H	H	O	
13-4	H	Me	OMe	H	CR ₃	H	H	O	
13-5	H	Me	OMe	H	CR ₃	H	H	S	
13-6	H	CF ₃	OMe	H	CR ₃	H	H	O	
13-7	H	CF ₃	OMe	H	CR ₃	H	H	S	
13-8	H	OMe	OMe	H	CR ₃	H	COOEt	O	1.553
13-9	H	OMe	OMe	H	CR ₃	H	COOH	O	164-166
13-10	H	OMe	OMe		N	H	H	O	
13-11	H	Me	OMe		N	H	H	O	
13-12	H	OMe	OMe	H	CR ₃	H	COOMe	O	91-93
13-13	H	OMe	OMe	H	CR ₃	H	p-Tos	O	136-138
13-14	H	OMe	OMe	H	CR ₃	H	COOPr-i	O	111-113
13-15	H	OMe	OMe	H	CR ₃	Me	H	O	
13-16	H	OMe	OMe	H	CR ₃	H	Me	O	
13-17	H	OMe	OMe	H	CR ₃	Me	Me	O	
13-18	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃	H	H		O	
13-19	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃	H	H		S	
13-20	H	Me	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃	H	H		O	
13-21	H	Me	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃	H	H		S	
13-22	H	CF ₃	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃	H	H		O	
13-23	H	CF ₃	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃	H	H		S	
13-24	H	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	S	
13-25	*1	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	130-132
13-26	2-Cl-4-Cl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	101-104
13-27	3-Cl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	125-127

第 13 表 (つづき)

No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	A	Y _{2,3}	Y _{2,4}	Z	物性値
13-28	3-F	Me	OMe	H	CR ₃	H	H	S	
13-29	3-F	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	141-142
13-30	3-Me-4-OMe	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	147-150
13-31	3-OMe	Me	OMe	H	CR ₃	H	H	O	
13-32	3-OMe	CF ₃	OMe	H	CR ₃	H	H	O	
13-33	3-OMe	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	148-149
13-34	4-Cl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	125-128
13-35	4-Cl-5-Me	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	158-160
13-36	4-Cl-6-Cl	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃	H	H		O	
13-37	4-COOMe	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	172
13-38	4-Me-5-Me	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	115-116
13-39	4-OMe	Me	OMe	H	CR ₃	H	H	O	
13-40	4-OMe	CF ₃	OMe	H	CR ₃	H	H	O	
13-41	4-OMe	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	92-94
13-42	4-OMe	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃	H	H		O	
13-43	5-Cl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	151-152
13-44	5-Et	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	87-89
13-45	5- <i>i</i> -Pr	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	1.425
13-46	5-Me	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	115-116
13-47	5-Me-6-Cl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	95-97
13-48	5-Me-6-Me	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	92-94
13-49	5-OMe	Me	OMe	H	CR ₃	H	H	O	
13-50	5-OMe	CF ₃	OMe	H	CR ₃	H	H	O	
13-51	5-OMe	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	123-125
13-52	5- <i>t</i> -Bu	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	Gum
13-53	6-(3,5-Dimethoxybenzoyloxy)	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	139-140
13-54	6-(3,5-Dimethoxybenzoyloxy)	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	130-131
13-55	6-(4-chlorobenzoyloxy)	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	
13-56	6-Br	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	117-120
13-57	6-Br	OMe	OMe	H	CR ₃	H	Me	O	
13-58	6-Br	OMe	OMe	H	CR ₃	Me	H	O	
13-59	6-Br	OMe	OMe	H	CR ₃	Me	Me	O	
13-60	6-CF ₃	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	100-102
13-61	6-CF ₃	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	S	

第 13 表 (つづき)

No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	A	Y _{2,3}	Y _{2,4}	Z	物性値
13-62	6-CH ₂ Br	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	
13-63	6-CH ₂ CN	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	
13-64	6-CH ₂ OMe	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	
13-65	6-CH ₂ SMe	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	
13-66	6-CH ₂ SO ₂ Me	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	
13-67	6-CH ₂ SO ₂ Ph	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	
13-68	6-CH ₂ SOMe	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	
13-69	6-CH ₂ SPh	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	
13-70	6-Cl	Me	Me	H	CR ₃	H	H	0	Gum
13-71	6-Cl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	112-113
13-72	6-Cl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	S	
13-73	6-Cl	Me	OMe	H	CR ₃	H	H	0	78-80
13-74	6-Cl	Me	OMe	H	CR ₃	H	H	S	
13-75	6-Cl	CF ₃	OMe	H	CR ₃	H	H	0	
13-76	6-Cl	CF ₃	OMe	H	CR ₃	H	H	S	
13-77	6-Cl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	COOEt	S	
13-78	6-Cl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	COOH	S	
13-79	6-Cl	OMe	OMe		N	H	H	0	164-165
13-80	6-Cl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	Me	0	Gum
13-81	6-Cl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	Et	0	83-86
13-82	6-Cl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	Bn	0	1.67
13-83	6-Cl	OMe	OMe	H	CR ₃	Me	H	0	
13-84	6-Cl	OMe	OMe	H	CR ₃	Me	Me	0	
13-85	6-Cl	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃		H	H	0	
13-86	6-Cl	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃		H	H	S	
13-87	6-Cl	Me	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃		H	H	0	
13-88	6-Cl	Me	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃		H	H	S	
13-89	6-Cl	CF ₃	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃		H	H	0	125-130
13-90	6-Cl	CF ₃	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃		H	H	S	
13-91	6-CN	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	
13-92	6-COOH	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	76-80
13-93	6-COOMe	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	112-113
13-94	6-Et	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	

第 13 表 (つづき)

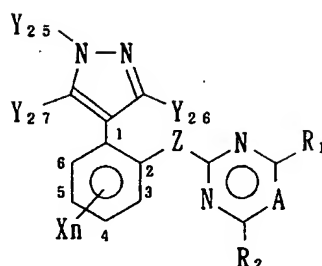
No	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	A	Y _{2,3}	Y _{2,4}	Z	物性値
13-95	6-F	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	77-78
13-96	6-F	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	S	
13-97	6-F	Me	OMe	H	CR ₃	H	H	0	
13-98	6-F	Me	OMe	H	CR ₃	H	H	S	
13-99	6-F	CF ₃	OMe	H	CR ₃	H	H	0	
13-100	6-F	CF ₃	OMe	H	CR ₃	H	H	S	
13-101	6-F	OMe	OMe	H	CR ₃	H	Me	0	1.474
13-102	6-F	OMe	OMe	H	CR ₃	Me	H	0	121-123
13-103	6-F	OMe	OMe	H	CR ₃	Me	Me	0	
13-104	6-F	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃	H	H		0	
13-105	6-F	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃	H	H		S	
13-106	6-F	Me	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃	H	H		0	
13-107	6-F	Me	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃	H	H		S	
13-108	6-F	CF ₃	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃	H	H		0	
13-109	6-F	CF ₃	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃	H	H		S	
13-110	6-I	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	128-130
13-111	6-I	OMe	OMe	H	CR ₃	H	Me	0	
13-112	6-I	OMe	OMe	H	CR ₃	Me	H	0	
13-113	6-I	OMe	OMe	H	CR ₃	Me	Me	0	
13-114	6-i-Pr	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	
13-115	6-Me	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	125-128
13-116	6-Me	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	S	
13-117	6-Me-4-OMe	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	96-99
13-118	6-NH ₂	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	95-97
13-119	6-NO ₂	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	144-146
13-120	6-NO ₂	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	S	
13-121	6-OAc	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	Gum
13-122	6-OMe	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	1.572
13-123	6-OBn	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	137-138
13-124	6-OC ₃ H ₇ COOEt	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	1.551
13-125	6-OC ₃ H ₇ COOH	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	159-160
13-126	6-OC ₅ H ₁₁ -n	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	1.532
13-127	6-OCH ₂ COOEt	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	95-97

第 13 表 (つづき)

No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	A	Y ₂₃	Y ₂₄	Z	物性値
13-128	6-OCH ₂ OMe	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	1.437
13-129	6-OCH ₂ SMe	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	
13-130	6-OCH ₂ SO ₂ Me	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	
13-131	6-CONHEt	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	118-120
13-132	6-CONHHex-c	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	143-144
13-133	6-CONHHex-n	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	94
13-134	6-OCSNHCODEt	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	Gum
13-135	6-OEt	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	87-88
13-136	6-OH	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	45-48
13-137	6-OMe	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	92-94
13-138	6-OMe	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	S	
13-139	6-OMe	Me	OMe	H	CR ₃	H	H	0	
13-140	6-OMe	CF ₃	OMe	H	CR ₃	H	H	0	
13-141	6-OMe	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃	H	H		0	
13-142	6-OPr-i	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	Gum
13-143	6-(p-Toluenesulfonyloxy)	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	111-112
13-144	6-Propargyloxy	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	120-121
13-145	6-SH	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	
13-146	6-SMe	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	89-90
13-147	6-SMe	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	S	
13-148	6-SO ₂ Me	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	171-173
13-149	6-SO ₂ Me	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	S	
13-150	6-SO ₂ Ph	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	142-145
13-151	6-SO ₂ Ph	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	S	
13-152	6-SOMe	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	
13-153	6-SOMe	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	S	
13-154	6-SOPh	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	
13-155	6-SOPh	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	S	
13-156	6-SPh	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	
13-157	6-SPh	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	S	
13-158	6-t-Bu	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	S	
13-159	H	OMe	OMe	H	CR ₃	Ph	Me	0	
13-160	H	OMe	OMe	H	CR ₃	H	COOEt	S	79-82

* 1: 5-CH=CH-CH=CH-6

第 14 表

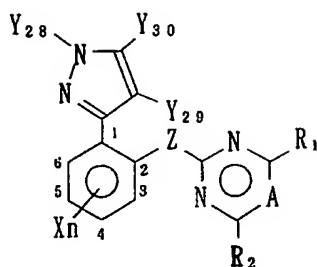


No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₂₅	Y ₂₆	Y ₂₇	A	Z	物性値
14-1	H	OMe	OMe	H	H	OH	H	CR ₃	0	
14-2	H	OMe	OMe	H	H	OH	Me	CR ₃	0	
14-3	H	OMe	OMe	H	H	OH	CF ₃	CR ₃	0	
14-4	H	OMe	OMe	H	H	OH	Ph	CR ₃	0	
14-5	H	OMe	OMe	H	H	OH	Cl	CR ₃	0	
14-6	H	OMe	OMe	H	H	OH	OH	CR ₃	0	
14-7	H	OMe	OMe	H	H	OH	OMe	CR ₃	0	
14-8	H	OMe	OMe	H	H	OH	SMe	CR ₃	0	
14-9	H	OMe	OMe	H	H	OH	SO ₂ Me	CR ₃	0	
14-10	H	OMe	OMe	H	H	OH	SH	CR ₃	0	
14-11	H	OMe	OMe	H	H	OH	NHMe	CR ₃	0	
14-12	H	OMe	OMe	H	H	OH	CN	CR ₃	0	
14-13	H	OMe	OMe	H	Me	H	H	CR ₃	0	90
14-14	H	OMe	OMe	H	Me	OH	Me	CR ₃	0	
14-15	H	OMe	OMe	H	Me	Me	OH	CR ₃	0	
14-16	H	OMe	OMe	H	Me	Cl	Me	CR ₃	0	
14-17	H	OMe	OMe	H	Me	Me	Cl	CR ₃	0	
14-18	H	OMe	OMe	H	Me	Cl	Cl	CR ₃	0	
14-19	H	OMe	OMe	H	Me	H	Me	CR ₃	0	
14-20	H	OMe	OMe	H	Me	H	Me	CR ₃	0	
14-21	H	OMe	OMe	H	Ph	Me	Cl	CR ₃	0	
14-22	H	OMe	OMe	H	Ph	Cl	Me	CR ₃	0	
14-23	H	OMe	OMe	H	Py*	H	H	CR ₃	0	175-176

* Py は 4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イルを表す。

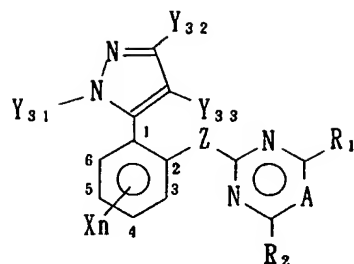
70

第 15 表



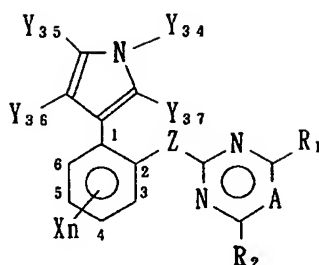
No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₂₈	Y ₂₉	Y ₃₀	A	Z	物性値
15-1	H	OMe	OMe	H	2-pyridyl	H	Cl	CR ₃	O	
15-2	H	OMe	OMe	H	2-pyridyl	H	OH	CR ₃	O	
15-3	H	OMe	OMe	H	H	H	Cl	CR ₃	O	
15-4	6-Cl	OMe	OMe	H	H	H	Cl	CR ₃	O	
15-5	H	OMe	OMe	H	H	H	COOMe	CR ₃	O	
15-6	H	OMe	OMe	H	H	H	H	CR ₃	O	
15-7	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -	H	H	H	H	CR ₃	O	
15-8	6-Cl	OMe	OMe	H	H	H	H	CR ₃	O	
15-9	H	OMe	OMe	H	H	H	Me	CR ₃	O	
15-10	H	OMe	OMe	H	H	H	OH	CR ₃	O	
15-11	6-Cl	OMe	OMe	H	H	H	OH	CR ₃	O	
15-12	6-F	OMe	OMe	H	H	H	OH	CR ₃	O	
15-13	6-F	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -	H	H	H	OH	CR ₃	O	
15-14	H	OMe	OMe	H	H	H	OMe	CR ₃	O	
15-15	H	OMe	OMe	H	Me	H	Cl	CR ₃	O	
15-16	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -	Me	H	H	H	CR ₃	O	
15-17	H	OMe	OMe	H	Me	H	OH	CR ₃	O	
15-18	H	OMe	OMe	H	Ph	H	Cl	CR ₃	O	
15-19	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -	Ph	H	H	H	CR ₃	O	
15-20	H	OMe	OMe	H	Ph	H	OH	CR ₃	O	

第 16 表



No	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₃₁	Y ₃₃	Y ₃₂	A	Z	物性値
16-1	H	OMe	OMe	H	2-pyridyl	H	Cl	CR ₃	O	
16-2	H	OMe	OMe	H	2-pyridyl	H	OH	CR ₃	O	
16-3	H	OMe	OMe	H	Et	H	Cl	CR ₃	O	
16-4	H	OMe	OMe	H	Et	H	H	CR ₃	O	
16-5	6-F	OMe	OMe	H	Et	H	OH	CR ₃	O	
16-6	6-Cl	OMe	OMe	H	Et	H	OH	CR ₃	O	
16-7	H	OMe	OMe	H	Me	H	Cl	CR ₃	O	
16-8	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		Me	H	H	CR ₃	O	
16-9	H	OMe	OMe	H	Me	H	OH	CR ₃	O	
16-10	6-Cl	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		Me	H	OH	CR ₃	O	
16-11	6-F	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		Me	H	OH	CR ₃	O	
16-12	H	OMe	OMe	H	Ph	H	Cl	CR ₃	O	
16-13	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		Ph	H	H	CR ₃	O	
16-14	H	OMe	OMe	H	Ph	H	OH	CR ₃	O	

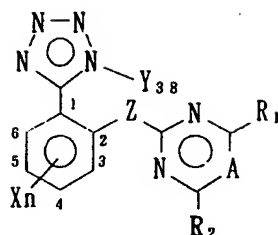
第 17 表



No.	X _n	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₃₄	Y ₃₅	Y ₃₆	Y ₃₇	A	Z	物性値
17-1	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	CR ₃	O	
17-2	H	OMe	OMe	H	H	H	CN	H	CR ₃	O	169-170
17-3	H	OMe	OMe	H	H	H	COOMe	H	CR ₃	O	
17-4	H	OMe	OMe	H	H	H	COOEt	H	CR ₃	O	153-155
17-5	H	OMe	OMe	H	H	H	COOH	H	CR ₃	O	220-225
17-6	H	OMe	OMe	H	H	H	NO ₂	H	CR ₃	O	
17-7	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	H	CN	H	CR ₃	O	
17-8	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	H	COOMe	H	CR ₃	O	
17-9	H	OMe	OMe	H	CHO	H	CN	H	CR ₃	O	
17-10	H	OMe	OMe	H	CHO	H	COOEt	H	CR ₃	O	
17-11	6-Cl	OMe	OMe	H	H	H	CN	H	CR ₃	O	
17-12	6-F	OMe	OMe	H	H	H	CN	H	CR ₃	O	
17-13	6-Cl	OMe	OMe	H	H	H	CN	H	CR ₃	S	
17-14	6-F	OMe	OMe	H	H	H	CN	H	CR ₃	S	
17-15	6-F	OMe	OMe	H	H	H	COOMe	H	CR ₃	O	180-181
17-16	6-Cl	OMe	OMe	H	H	H	COOMe	H	CR ₃	O	
17-17	6-OPy*	OMe	OMe	H	H	H	COOEt	H	CR ₃	O	165-168

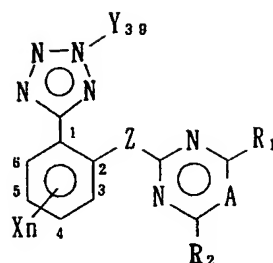
* Py は 4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イルを表す。

第 18 表



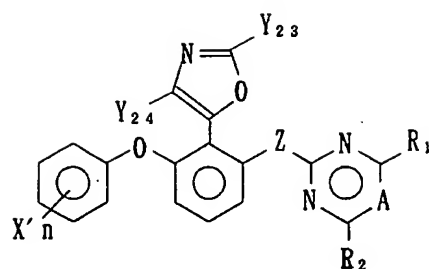
No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₃₈	A	Z	物性値
18-1	H	OMe	OMe	H	H	CR ₃	0	146-148
18-2	H	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	0	
18-3	H	OMe	OMe	H	Et	CR ₃	0	amorphous
18-4	H	OMe	OMe	H	i-Pr	CR ₃	0	100-102
18-5	H	OMe	OMe	H	Ph	CR ₃	0	
18-6	H	OMe	OMe	H	CH ₂ Ph	CR ₃	0	Gum
18-7	H	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	CR ₃	0	
18-8	H	OMe	OMe	H	Na	CR ₃	0	123-127
18-9	H	OMe	OMe	H	CH ₂ SMe	CR ₃	0	Gum
18-10	H	OMe	OMe	H	CH ₂ SO ₂ Me	CR ₃	0	54-56
18-11	H	OMe	OMe	H	CH ₂ OMe	CR ₃	0	86-89
18-12	H	OMe	OMe	H	CH ₂ COOMe	CR ₃	0	amorphous
18-13	H	OMe	OMe	H	CH ₂ COOH	CR ₃	0	170-172
18-14	H	OMe	OMe	H	CH ₂ CN	CR ₃	0	
18-15	H	OMe	OMe	H	Ac	CR ₃	0	
18-16	H	OMe	OMe	H	2-Cl-PhCO	CR ₃	0	
18-17	H	OMe	OMe	H	SO ₂ Me	CR ₃	0	91-93
18-18	H	OMe	OMe	H	SO ₂ Tol-p	CR ₃	0	
18-19	H	OMe	OMe	H	SO ₂ NMe ₂	CR ₃	0	
18-20	H	OMe	OMe	H	NH ₂	CR ₃	0	
18-21	H	OMe	OMe	H	NHCOOBt	CR ₃	0	
18-22	H	OMe	OMe	H	NHPh	CR ₃	0	
18-23	6-Cl	OMe	OMe	H	H	CR ₃	0	
18-24	6-Cl	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	0	
18-25	6-Cl	OMe	OMe	H	c-Hex	CR ₃	0	
18-26	H	OMe	OMe	H	K	CR ₃	0	230-235
18-27	6-Cl	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	S	
18-28	6-Cl	OMe	OMe	H	c-Hex	CR ₃	S	
18-29	H	OMe	OMe	H	H	CR ₃	S	
18-30	6-F	OMe	OMe	H	H	CR ₃	0	
18-31	6-F	OMe	OMe	H	H	CR ₃	S	
18-32	H	OMe	OMe	H	t-Bu	CR ₃	0	
18-33	H	OMe	OMe	H	2-Pyridyl	CR ₃	0	

第 19 表



No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₃	A	Z	物性値
19-1	H	OMe	OMe	H	n-Bu	CR ₃	0	
19-2	H	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	0	114-116
19-3	H	OMe	OMe	H	Et	CR ₃	0	Gum
19-4	H	OMe	OMe	H	i-Pr	CR ₃	0	Gum
19-5	H	OMe	OMe	H	Ph	CR ₃	0	
19-6	H	OMe	OMe	H	CH ₂ Ph	CR ₃	0	Gum
19-7	H	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	CR ₃	0	
19-8	H	OMe	OMe	H	CH ₂ Br	CR ₃	0	
19-9	H	OMe	OMe	H	CH ₂ SMe	CR ₃	0	Gum
19-10	H	OMe	OMe	H	CH ₂ SO ₂ Me	CR ₃	0	165-167
19-11	H	OMe	OMe	H	CH ₂ OMe	CR ₃	0	Gum
19-12	H	OMe	OMe	H	CH ₂ COOMe	CR ₃	0	amorphous
19-13	H	OMe	OMe	H	CH ₂ COOH	CR ₃	0	181-183
19-14	H	OMe	OMe	H	CH ₂ CN	CR ₃	0	
19-15	H	OMe	OMe	H	Ac	CR ₃	0	140-142
19-16	H	OMe	OMe	H	2-Cl-PhCO	CR ₃	0	
19-17	H	OMe	OMe	H	SO ₂ Me	CR ₃	0	
19-18	H	OMe	OMe	H	SO ₂ Tol-p	CR ₃	0	
19-19	H	OMe	OMe	H	SO ₂ NMe ₂	CR ₃	0	
19-20	H	OMe	OMe	H	NH ₂	CR ₃	0	
19-21	H	OMe	OMe	H	NHCOEt	CR ₃	0	
19-22	H	OMe	OMe	H	NHPh	CR ₃	0	
19-23	6-Cl	OMe	OMe	H	H	CR ₃	0	
19-24	6-Cl	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	0	
19-25	6-Cl	OMe	OMe	H	c-Hex	CR ₃	0	
19-26	6-Cl	OMe	OMe	H	H	CR ₃	S	
19-27	6-Cl	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	S	
19-28	6-Cl	OMe	OMe	H	c-Hex	CR ₃	S	
19-29	H	OMe	OMe	H	H	CR ₃	S	
19-30	6-F	OMe	OMe	H	H	CR ₃	0	
19-31	6-F	OMe	OMe	H	H	CR ₃	S	
19-32	H	OMe	OMe	H	t-Bu	CR ₃	0	
19-33	H	OMe	OMe	H	2-Pyridyl	CR ₃	0	

第 20 表

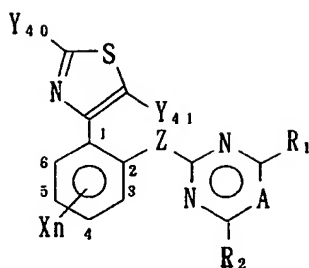


No.	X'_n	R_1	R_2	R_3	A	Y_{23}	Y_{24}	Z	物性値
20-1	H	Me	Me	H	CR_3	H	H	O	
20-2	3,5-Dimethyl	OMe	OMe	H	CR_3	H	H	O	Gum
20-3	3-Bu-t	OMe	OMe	H	CR_3	H	H	O	1.548
20-4	4-Cl	OMe	OMe	H	CR_3	H	H	O	92-95
20-5	2-OMe	OMe	OMe	H	CR_3	H	H	O	
20-6	H	OMe	OMe	H	CR_3	H	Bn	O	
20-7	4-OMe	OMe	OMe	H	CR_3	H	H	O	94-96
20-8	4-CN	OMe	OMe	H	CR_3	H	H	O	Gum
20-9	2,5-Dimethyl	OMe	OMe	H	CR_3	H	H	O	Gum
20-10	3,5-Dimethoxy	OMe	OMe	H	CR_3	H	H	O	107-110
20-11	H	OMe	OMe	H	CR_3	Me	H	O	
20-12	3-F	OMe	OMe	H	CR_3	H	H	O	
20-13	2,4,6-Trimethyl	OMe	OMe	H	CR_3	H	H	O	163-165
20-14	2-Ph	OMe	OMe	H	CR_3	H	H	O	119-121
20-15	4-NO ₂	OMe	OMe	H	CR_3	H	H	O	
20-16	3,4-Dimethyl	OMe	OMe	H	CR_3	H	H	O	Gum
20-17	H	OMe	OMe	H	CR_3	H	Me	O	1.571
20-18	2-NO ₂	OMe	OMe	H	CR_3	H	H	O	
20-19	2-NH ₂ -4-CF ₃	OMe	OMe	H	CR_3	H	H	O	
20-20	2,6-Dimethyl	OMe	OMe	H	CR_3	H	H	O	141-143
20-21	2-(CH) ₄ -3	OMe	OMe	H	CR_3	H	H	O	89-92
20-22	H	OMe	OMe	H	CR_3	H	H	O	1.603
20-23	2-F	OMe	OMe	H	CR_3	H	H	O	
20-24	2-CONH ₂	OMe	OMe	H	CR_3	H	H	O	
20-25	3-NO ₂	OMe	OMe	H	CR_3	H	H	O	

第 20 表 (つづき)

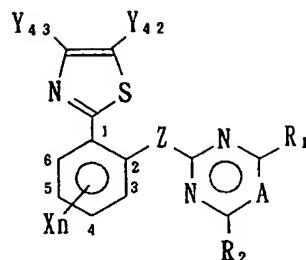
No.	X' n	R ₁	R ₂	R ₃	A	Y ₂₃	Y ₂₄	Z	物性値
20-26	3-CN	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	
20-27	4-Me	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	125-127
20-28	4-F	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	73-75
20-29	H	OMe	OMe		N	H	H	O	97-99
20-30	3-NMe ₂	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	1.594
20-31	3-Me	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	70-72
20-32	3-Cl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	
20-33	2-Me	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	130-132
20-34	2,3-Dimethyl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	80-82
20-35	3-OMe	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	Gum
20-36	2-NO ₂ -CF ₃	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	108-109
20-37	2-Cl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	
20-38	2,4-Dimethyl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	99-102
20-39	2-CN	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	O	
20-40	H	OMe	OMe	H	CR ₃	Me	Me	O	

第 21 表



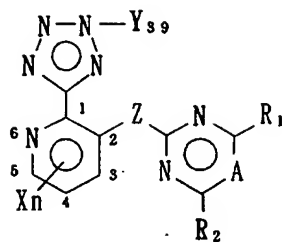
No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₄₀	Y ₄₁	A	Z	物性値
21-1	H	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	O	
21-2	6-F	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	O	
21-3	6-Cl	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	O	
21-4	H	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	S	
21-5	H	OMe	OMe	H	Me	H	CR ₃	O	109-110
21-6	6-Cl	OMe	OMe	H	Me	H	CR ₃	O	
21-7	6-F	OMe	OMe	H	Me	H	CR ₃	O	
21-8	6-OMe	OMe	OMe	H	Me	H	CR ₃	O	
21-9	H	OMe	OMe	H	4-Cl-Ph	H	CR ₃	O	
21-10	H	OMe	OMe	H	Ph	H	CR ₃	O	
21-11	H	OMe	OMe	H	Me	Me	CR ₃	O	
21-12	6-F	OMe	OMe	H	Me	Me	CR ₃	O	
21-13	6-Cl	OMe	OMe	H	Me	Me	CR ₃	O	
21-14	6-Br	OMe	OMe	H	Me	Me	CR ₃	O	
21-15	6-I	OMe	OMe	H	Me	Me	CR ₃	O	
21-16	H	OMe	OMe	H	NHPh	Me	CR ₃	O	

第 22 表



No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₄₂	Y ₄₃	A	Z	物性値
22-1	H	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	O	
22-2	6-F	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	O	
22-3	6-Cl	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	O	
22-4	H	OMe	OMe	H	-(CH) ₄ -		CR ₃	O	Gum
22-5	H	OMe	OMe	H	H	H	CR ₃	S	
22-6	H	OMe	OMe	H	H	Me	CR ₃	O	
22-7	H	OMe	OMe	H	H	Ph	CR ₃	O	
22-8	H	OMe	OMe	H	H	OH	CR ₃	O	
22-9	H	OMe	OMe	H	H	Cl	CR ₃	O	
22-10	H	OMe	OMe	H	H	SMe	CR ₃	O	
22-11	H	OMe	OMe	H	H	NHMe	CR ₃	O	
22-12	H	OMe	OMe	H	H	COOMe	CR ₃	O	
22-13	H	OMe	OMe	H	H	COOH	CR ₃	O	
22-14	H	OMe	OMe	H	H	OMe	CR ₃	O	
22-15	6-Cl	OMe	OMe	H	H	COOMe	CR ₃	O	
22-16	6-F	OMe	OMe	H	H	CF ₃	CR ₃	O	
22-17	6-Cl	OMe	OMe	H	H	CF ₃	CR ₃	O	

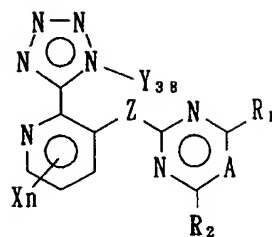
第 23 表



No.	X_n	R_1	R_2	R_3	A	Y_{39}	Z	物性値
23-1	H	OMe	OMe	H	CR_3	H	0	180
23-2	H	OMe	OMe	H	CR_3	Me	0	
23-3	H	OMe	OMe	H	CR_3	Ac	0	
23-4	H	OMe	OMe	H	CR_3	SO_2Me	0	
23-5	H	OMe	$-OCH_2CH_2-$		CR_3	H	0	
23-6	H	OMe	$-OCH_2CH_2-$		CR_3	Me	0	
23-7	H	OMe	$-OCH_2CH_2-$		CR_3	Ac	0	
23-8	H	OMe	$-OCH_2CH_2-$		CR_3	SO_2Me	0	
23-9	H	Me	Me	H	CR_3	H	0	
23-10	H	OMe	Cl	H	CR_3	H	0	

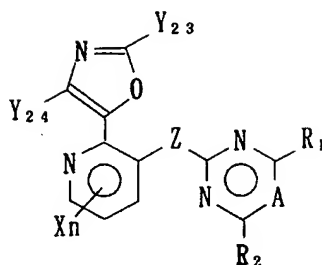
80

第 24 表



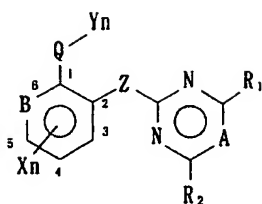
No.	X_n	R_1	R_2	R_3	A	Y_{38}	Z	物性値
24-1	H	OMe	OMe	H	CR_3	Me	O	
24-2	H	OMe	OMe	H	CR_3	Ac	O	
24-3	H	OMe	OMe	H	CR_3	SO_2Me	O	
24-4	H	OMe	$-OCH_2CH_2-$		CR_3	Me	O	
24-5	H	OMe	$-OCH_2CH_2-$		CR_3	Ac	O	
24-6	H	OMe	$-OCH_2CH_2-$		CR_3	SO_2Me	O	

第 25 表



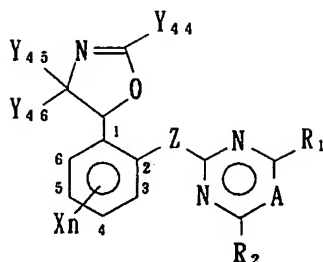
No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	A	Y ₂₃	Y ₂₄	Z	物性値
25-1	H	OMe	OMe	H	CR ₃	H	H	0	135-138
25-2	H	OMe	OMe	H	CR ₃	H	COOEt	0	
25-3	H	OMe	OMe	H	CR ₃	H	COOMe	0	
25-4	H	OMe	OMe	H	CR ₃	H	COOH	0	
25-5	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃	CR ₃	H	H	0	
25-6	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃	CR ₃	H	COOEt	0	
25-7	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃	CR ₃	H	COOMe	0	
25-8	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -	CR ₃	CR ₃	H	COOH	0	
25-9	H	Me	Me	H	CR ₃	H	H	0	
25-10	H	OMe	Cl	H	CR ₃	H	H	0	
25-11	H	OMe	OMe	H	CR ₃	H	p-Toluenesulfonyl	0	Gum

第 26 表



No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	Q-Yn	A	B	Z	物性値
26-1	H	OMe	OMe	H	3-methoxycarbonylpyrrol-4-yl	CR ₃	N	O	
26-2	H	OMe	OMe	H	3-cyanopyrrol-4-yl	CR ₃	N	O	
26-3	H	OMe	OMe	H	pyrazol-4-yl	CR ₃	N	O	
26-4	H	OMe	OMe	H	isoxazol-4-yl	CR ₃	N	O	
26-5	H	OMe	OMe	H	thiazol-2-yl	CR ₃	N	O	
26-6	H	OMe	OMe	H	imidazol-4-yl	CR ₃	N	O	
26-7	H	OMe	OMe		oxazol-4-yl	N	N	O	
26-8	H	OMe	OMe		tetrazol-5-yl	N	N	O	
26-9	H	OMe	OMe		3-cyanopyrrol-4-yl	N	N	O	
26-10	H	OMe	OMe		pyrazol-4-yl	N	N	O	
26-11	H	OMe	OMe		isoxazol-4-yl	N	N	O	
26-12	H	OMe	OMe		thiazol-2-yl	N	N	O	
26-13	H	OMe	OMe		imidazol-4-yl	N	N	O	
26-14	H	OMe	OMe	H	3-methyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl	CR ₃	N	O	128-132
26-15	H	OMe	OMe	H	5-trifluoromethyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	CR ₃	N	O	
26-16	H	OMe	OMe	H	4-(p-toluenesulfonyl)-2-oxazolin-5-yl	CR ₃	N	O	Gum
26-17	H	OMe	OMe	H	5-trifluoromethyl-1,3,4-triazol-2-yl	CR ₃	N	O	
26-18	H	OMe	OMe	H	3-ethoxycarbonylpyrrol-4-yl	CR ₃	N	O	75-80
26-19	H	OMe	OMe	H	5-trifluoromethyl-1,3,4-triazol-3-yl	CR ₃	C	O	
26-20	6-F	OMe	OMe	H	5-trifluoromethyl-1,3,4-triazol-3-yl	CR ₃	C	O	
26-21	H	OMe	OMe	H	6-pyridazinon-3-yl	CR ₃	C	O	
26-22	H	OMe	OMe	H	1-methylpyridazin-6-on-3-yl	CR ₃	C	O	
26-23	H	OMe	OMe	H	4,5-dimethoxycarbonylpyrrol-2-yl	CR ₃	C	O	
26-24	H	OMe	OMe	H	pyridazin-6-on-3-yl	CR ₃	C	O	154-156
26-25	H	OMe	OMe	H	1-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)- -pyridazin-6-on-3-yl	CR ₃	C	O	175-177

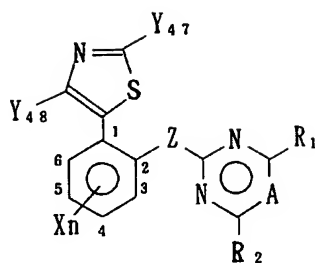
第 27 表



No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	A	Y ₄₄	Y ₄₅	Y ₄₆	Z	物性値
27-1	H	OMe	OMe	H	CR ₃	H	COOEt	H	O	
27-2	6-Cl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	COOEt	H	O	
27-3	6-F	OMe	OMe	H	CR ₃	H	COOEt	H	O	
27-4	H	OMe	OMe	H	CR ₃	H	p-Tos	H	O	148-152
27-5	6-Cl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	p-Tos	H	O	142-143
27-6	6-F	OMe	OMe	H	CR ₃	H	p-Tos	H	O	145-147
27-7	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ O-	CR ₃	H	p-Tos	H	O		
27-8	6-Cl	OMe	-OCH ₂ CH ₂ O-	CR ₃	H	p-Tos	H	O		
27-9	H	Me	Me	H	CR ₃	H	p-Tos	H	O	
27-10	H	OMe	Cl	H	CR ₃	H	p-Tos	H	O	
27-11	6-SPh	OMe	OMe	H	CR ₃	H	p-Tos	H	O	146
27-12	6-Cl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	SMe	H	O	Gum
27-13	5-Me-6-Cl	OMe	OMe	H	CR ₃	H	p-Tos	H	O	155-158
27-14	6-F	OMe	OMe	H	CR ₃	H	SMe	H	O	1.452
27-15	5-Me	OMe	OMe	H	CR ₃	H	p-Tos	H	O	153-155
27-16	5-Et	OMe	OMe	H	CR ₃	H	p-Tos	H	O	
27-17	5-Pr-i	OMe	OMe	H	CR ₃	H	p-Tos	H	O	
27-18	5-Bu-t	OMe	OMe	H	CR ₃	H	p-Tos	H	O	
27-19	4-Cl-5-Me	OMe	OMe	H	CR ₃	H	p-Tos	H	O	
27-20	6-OPh	OMe	OMe	H	CR ₃	H	p-Tos	H	O	56-59
27-21	6-OC ₆ H ₄ Cl-4	OMe	OMe	H	CR ₃	H	p-Tos	H	O	154-157
27-22	6-Br	OMe	OMe	H	CR ₃	H	p-Tos	H	O	
27-23	6-I	OMe	OMe	H	CR ₃	H	p-Tos	H	O	
27-24	6-F	OMe	OMe	H	CR ₃	H	p-Tos	Me	O	138-140
27-25	6-F	OMe	OMe	H	CR ₃	H	p-Tos	CH ₂ Ph	O	
27-26	6-OPh	OMe	OMe	H	CR ₃	H	SPh	H	O	

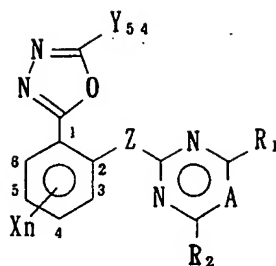
p-Tos: p-toluenesulfonyl

第 28 表



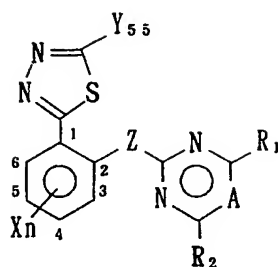
No.	X _n	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₄₇	Y ₄₈	A	Z	物性値
28-1	6-F	OMe	OMe	H	Me	Me	CR ₃	0	1.580
28-2	H	OMe	OMe	H	Me	Me	CR ₃	0	
28-3	6-Cl	OMe	OMe	H	Me	Me	CR ₃	0	
28-4	6-Br	OMe	OMe	H	Me	Me	CR ₃	0	
28-5	6-I	OMe	OMe	H	Me	Me	CR ₃	0	
28-6	6-OPh	OMe	OMe	H	Me	Me	CR ₃	0	
28-7	6-F	OMe	OMe	H	H	Me	CR ₃	0	
28-8	H	OMe	OMe	H	H	Me	CR ₃	0	
28-9	6-Cl	OMe	OMe	H	H	Me	CR ₃	0	
28-10	6-Br	OMe	OMe	H	H	Me	CR ₃	0	
28-11	6-I	OMe	OMe	H	H	Me	CR ₃	0	
28-12	6-OPh	OMe	OMe	H	H	Me	CR ₃	0	
28-13	6-F	OMe	OMe	H	H	Ph	CR ₃	0	
28-14	H	OMe	OMe	H	H	Ph	CR ₃	0	
28-15	6-Cl	OMe	OMe	H	H	Ph	CR ₃	0	
28-16	6-Br	OMe	OMe	H	H	Ph	CR ₃	0	
28-17	6-I	OMe	OMe	H	H	Ph	CR ₃	0	
28-18	6-OPh	OMe	OMe	H	H	Ph	CR ₃	0	
28-19	6-OPy*	OMe	OMe	H	Me	Me	CR ₃	0	
28-20	6-OH	OMe	OMe	H	Me	Me	CR ₃	0	

第 29 表



No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₅₄	A	Z	物性値
29-1	H	OMe	OMe	H	H	CR ₃	O	170-172
29-2	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	CR ₃	O	
29-3	H	OMe	OMe	H	H	CR ₃	S	
29-4	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	CR ₃	S	
29-5	H	OMe	Me	H	H	CR ₃	O	
29-6	H	OMe	CF ₃	H	H	CR ₃	O	
29-7	H	OMe	NMe ₂	H	H	CR ₃	O	
29-8	H	OMe	-OCH=CH-		H	CR ₃	O	
29-9	H	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	O	
29-10	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		Me	CR ₃	O	
29-11	H	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	S	
29-12	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		Me	CR ₃	S	
29-13	H	OMe	OMe	Cl	Me	CR ₃	O	
29-14	H	OMe	OMe	Br	Me	CR ₃	O	
29-15	H	Me	Me	H	Me	CR ₃	O	
29-16	6-Cl	OMe	OMe	H	H	CR ₃	O	

第 30 表



No.	Xn	R ₁	R ₂	R ₃	Y ₅₅	A	Z	物性値
30-1	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		H	CR ₃	O	
30-2	H	OMe	OMe	H	H	CR ₃	O	
30-3	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		Me	CR ₃	O	
30-4	H	Me	Me	H	Me	CR ₃	O	
30-5	H	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	O	
30-6	H	OMe	OMe	Cl	Me	CR ₃	O	
30-7	H	OMe	OMe	Br	Me	CR ₃	O	
30-8	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		Me	CR ₃	S	
30-9	H	OMe	OMe	H	Me	CR ₃	S	
30-10	6-Cl	OMe	OMe	H	NH ₂	CR ₃	O	
30-11	6-Cl	OMe	OMe	H	NH ₂	CR ₃	S	
30-12	6-Cl	OMe	OMe	H	OE _t	CR ₃	O	
30-13	6-Cl	OMe	OMe	H	OE _t	CR ₃	S	
30-14	6-Cl	OMe	OMe	H	Ph	CR ₃	O	
30-15	6-Cl	OMe	OMe	H	Ph	CR ₃	S	
30-16	H	OMe	-OCH=CH-	H	SMe	CR ₃	O	
30-17	H	OMe	CF ₃	H	SMe	CR ₃	O	
30-18	H	OMe	Me	H	SMe	CR ₃	O	
30-19	H	OMe	NMe ₂	H	SMe	CR ₃	O	
30-20	H	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		SMe	CR ₃	S	
30-21	H	OMe	OMe	H	SMe	CR ₃	S	
30-22	6-Cl	OMe	OMe	H	SO ₂ Me	CR ₃	O	
30-23	6-Cl	OMe	OMe	H	SO ₂ Me	CR ₃	S	

第 31 表

化合物 番 号	化合物のNMRデータ (δ 値)
5-12	3.80(s, 6H), 5.78(s, 1H), 6.70(d, 1H), 7.25-7.52(m, 3H), 8.05(dd, 1H), 8.23(d, 1H)
6-3	3.78(s, 6H), 5.71(s, 1H), 6.77(d, 1H), 7.25-7.52(m, 3H), 7.98-8.03(m, 1H), 8.37(d, 1H)
10-5	3.82(s, 6H), 5.74(s, 1H), 7.18(t, 2H), 7.27(s, 1H), 7.35(s, 1H), 7.50(t, 1H), 7.57(s, 1H), 7.96(m, 1H), 8.19(m, 1H)
10-10	2.23(s, 3H), 3.79(s, 12H), 5.72(s, 2H), 7.18(d, 2H), 7.24(s, 1H), 7.40(t, 1H)
10-12	3.80(s, 6H), 3.98(s, 6H), 5.75(s, 1H), 7.25(d, 1H), 7.20(d, 1H), 7.39(s, 1H), 7.45(t, 1H), 7.76(s, 1H)
10-14	2.35(s, 6H), 3.80(s, 6H), 5.72(s, 1H), 6.72(s, 1H), 7.12-7.20(m, 2H), 7.31(s, 1H), 7.45(t, 1H), 7.68(s, 1H)
13-52	1.40(s, 9H), 3.81(s, 6H), 5.76(s, 1H), 7.19-7.28(m, 1H), 7.36-7.46(m, 1H), 7.49(s, 1H), 7.83(d, 1H), 7.90(s, 1H)
13-70	2.35(s, 6H), 6.72(s, 1H), 7.21-7.37(m, 2H), 7.40(s, 1H), 7.35-7.45(m, 1H), 7.87(s, 1H)
13-80	2.19(s, 3H), 3.76(s, 6H), 5.70(s, 1H), 7.20(dd, 1H), 7.40(s, 1H), 7.42(d, 1H), 7.80(d, 1H)
13-134	1.35(s, 3H), 3.79(s, 6H), 4.30(q, 2H), 5.74(s, 1H), 7.20(dt, 2H), 7.39-7.51(m, 2H), 7.87(s, 1H)
13-142	1.35(d, 6H), 3.78(s, 6H), 4.55-4.75(m, 1H), 5.70(s, 1H), 6.85(t, 2H), 7.30(t, 1H), 7.43(s, 1H), 7.79(s, 1H)
18-3	1.52(t, 3H), 3.74(d, 6H), 4.41(dd, 2H), 7.28-7.69(m, 4H)
18-6	3.77(s, 6H), 5.62(s, 2H), 5.71(s, 1H), 7.02-7.43(m, 8H), 7.55-7.65(m, 1H)
18-9	2.16(s, 3H), 3.77(s, 6H), 5.49(s, 2H), 5.71(s, 1H), 7.33-7.72(m, 4H)
18-12	3.69(s, 3H), 3.77(s, 6H), 5.32(s, 2H), 5.71(s, 1H), 7.31-7.73(m, 4H)
19-3	1.50(t, 3H), 3.74(s, 6H), 4.57(dd, 2H), 5.69(s, 1H), 7.29-7.56(m, 3H), 8.22(dd, 1H)

第 31 表 (つづき)

化合物 番 号	化合物のNMRデータ (δ 値)
19-4	1.53(d, 6H), 3.73(s, 6H), 4.92-5.04(m, 1H), 5.68(s, 1H), 7.28-7.55(m, 3H), 8.23(dd, 1H)
19-6	3.68(s, 6H), 5.60(s, 1H), 5.67(s, 2H), 7.15-7.56(m, 8H), 8.24(dd, 1H)
19-9	2.13(s, 3H), 3.74(s, 6H), 5.50(s, 2H), 5.69(s, 1H), 7.31-7.59(m, 3H), 8.24(dd, 1H)
19-11	3.32(s, 3H), 3.74(s, 6H), 5.69(s, 1H), 5.77(s, 2H), 7.31-7.60(m, 3H), 8.25(dd, 1H)
19-12	3.74(s, 9H), 5.34(s, 2H), 5.68(s, 1H), 7.31-7.56(m, 3H), 8.23(dd, 1H)
20-2	2.29(s, 6H), 3.81(s, 6H), 5.72(s, 1H), 6.62(d, 2H), 6.76(d, 1H), 6.89(m, 1H), 7.04(m, 1H), 7.32(t, 1H), 7.40(s, 1H), 7.79(s, 1H)
20-8	3.81(s, 6H), 5.76(s, 1H), 6.95-7.05(m, 3H), 7.17-7.31(m, 2H), 7.40-7.50(m, 1H), 7.55-7.62(m, 2H), 7.75(d, 1H)
20-9	2.18(s, 3H), 2.29(s, 3H), 3.81(s, 6H), 5.73(s, 1H), 6.61-6.72(m, 2H), 6.88-7.00(m, 2H), 7.13(d, 1H), 7.26(d, 1H), 7.43(s, 1H), 7.81(s, 1H)
20-16	2.22(s, 6H), 3.80(s, 6H), 5.72(s, 1H), 6.69-6.88(m, 3H), 6.99-7.10(m, 2H), 7.29(t, 1H), 7.40(s, 1H), 7.79(s, 1H)
20-35	3.78(s, 3H), 3.81(s, 6H), 5.73(s, 1H), 6.53-6.69(m, 3H), 6.92(d, 1H), 7.06(d, 1H), 7.17-7.40(m, 3H), 7.79(s, 1H)
22-4	3.82(s, 6H), 5.78(s, 1H), 7.25-7.60(m, 5H), 7.88(d, 1H), 8.05(d, 1H), 8.49(dd, 1H)
25-11	2.42(s, 3H), 3.76(s, 6H), 5.81(s, 1H), 7.29(d, 2H), 7.34(dd, 1H), 7.65(d, 1H), 7.77(d, 2H), 7.78(s, 1H), 8.43(dd, 1H)
26-16	2.45(s, 3H), 3.83(s, 6H), 5.85(s, 1H), 5.88(d, 1H), 6.33(d, 1H), 7.02(d, 1H), 7.34(d, 2H), 7.39(dd, 1H), 7.60(s, 1H), 7.81(d, 2H), 8.49(dd, 1H)

本発明化合物又はその塩は、畑作条件で、土壌処理、茎葉処理のいずれの方法でも高い除草活性を示す。特に茎葉散布処理で、メヒシバ、カヤツリグサ、イチビ、イヌビユ等の各種の畑雑草に高い効力を示し、トウモロコシ、ムギ、大豆、ワタ等の作物に選択性を示す化合物も含まれている。

本発明化合物又はその塩は、水田雑草のノビエ、タマガヤツリ、オモダカ、ホタルイ等の雑草に対し、優れた殺草効力を有し、イネに選択性を示す化合物も含まれている。

また本発明化合物又はその塩は、果樹園、芝生、線路端、空き地等の雑草の防除にも適用することが出来る。

更に本発明化合物又はその塩には植物生長調節作用を有するものも含まれる。

本発明除草剤は、前記一般式〔1〕で示される化合物もしくはその塩の1又は2以上を有効成分として含有し、通常の農薬と同様の形態を有する。即ち、有効成分化合物は一般に適当な量を担体と混合して水和剤、乳剤、粒剤、水溶剤、フロアブル剤等の形に製剤化して使用される。固体担体としてはタルク、ホワイカーボン（シリカ）、ベントナイト、クレイ、ケイソウ土等が挙げられ、液体担体としては、水、アルコール、ベンゼン、キシレン、ケロシン、鉱油、シクロヘキサン、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド等が用いられる。これらの製剤に於て、均一かつ安定な形態を取るために必要ならば、界面活性剤を添加することもできる。

本発明除草剤における有効成分濃度は前述した製剤の形により種々の濃度に変化するものであるが、例えば、水和剤に於いては、5～90%、好ましくは10～85%：乳剤に於いては、3～70%、好ましくは5～30%：粒剤に於いては、0.01～30%、好ましくは、0.05～10%の濃度が用いられる。

このようにして得られた水和剤、乳剤は水で所定の濃度に希釈して懸濁液或は乳濁液として、粒剤はそのまま雑草の発芽前又は発芽後に散布処理もしくは混和処理される。実際に本発明除草剤を適用するに当たっては10アール当り有効成分0.1g以上の適当量が施用される。

又、本発明除草剤は公知の殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤、植物成長調整剤等と混合して使用することも出来る。特に、除草剤と混合使用することにより、使用薬量を減少させることが可能である。又、省力化をもたらすのみならず、混合薬剤の相乗作用により一層高い効果も期待できる。その場合、複数の公知除草剤との組合せも可能である。本発明除草剤と混合使用するにふさわしい薬剤としては、ベンチオカーブ、モリネート、ジメピペレート等のカーバメイト系除草剤、チオカーバメイト系除草剤、ブタクロール、プレチラクロール、メフェナセツト等の酸アミド系除草剤、クロメトキシニル、ピフェノックス等のジフェニルエーテル系除草剤、アトラジン、シアナジン等のトリアジン系除草剤、クロルスルフロロン、スルホメチュロンーメチル等のスルホニルウレア系除草剤、MCP, MCPB等のフェノキシアルカンカルボン酸系除草剤、ジクロホップーメチル等のフェノキシフェノキシプロピオン酸系除草剤、フルアジホップブチル等のピリジリオキシフェノキシプロピオン酸系除草剤、ベンゾイルプロップエチル、フランプロップエチル等のベンゾイルアミノプロピオン酸系除草剤、イマザキン等のイミダゾリノン系除草剤、その他として、ピペロホス、ダイムロン、ペンタゾン、ダイフェンゾコート、ナプロアニリド、HW-52(4-エトキシメトキシベンズ-2,3-ジクロルアニライド)、トリアゾフェナミド、キンクロラック、更に、セトキシジム、アロキシジムーソディウム等のシクロヘキサジオン系の除草剤等が挙げられる。又、これらの組み合わせた物に植物油及び油濃縮物を添加することも出来る。

次に、本発明除草剤に関する製剤例を若干示すが、有効成分化合物、添加物及び添加割合は、本実施例にのみ限定されることなく、広い範囲で変更可能である。

実施例 27 水和剤

本発明化合物	20部
ホワイトカーボン	20部
ケイソウ土	52部
アルキル硫酸ソーダ	8部

以上を均一に混合、微細に粉碎して、有効成分20%の水和剤を得た。

実施例 28 乳剤

本発明化合物	20部
キシレン	55部
ジメチルホルムアミド	15部
ポリオキシエチレンフェニルエーテル	10部

以上を混合、溶解して有効成分20%の乳剤を得た。

実施例 29 粒剤

本発明化合物	5部
タルク	40部
クレー	38部
ベントナイト	10部
アルキル硫酸ソーダ	7部

以上を均一に混合して微細に粉碎後、直径0.5～1.0mmの粒状に造粒して有効成分5%の粒剤を得た。

産業上の利用可能性：

次に本発明除草剤の効果に関する試験例を示す。

試験例 1 茎葉散布処理

200cm²のポットに土壌を充填し、表層にメヒシバ、カヤツリグサ、イヌビユの各種子を播き、軽く覆土後温室内で生育させた。各雑草が5～10cmの草丈に生育した時点で各供試化合物の乳剤を水で希釈して調整した4000ppmの薬液を100l/10aの割合(10a当り400g相当)で小型噴霧器にて雑草の茎葉部に散布した。3週間後に雑草の除草効果を下記の調査基準に従って調査し、その結果を以下の表32に示した。

調査基準

殺草率	殺草指数
0 %	0
20～29 %	2
40～49 %	4
60～69 %	6
80～89 %	8
100 %	10

又、1, 3, 5, 7, 9の数値は、各々0と2, 2と4, 4と6, 6と8, 8と10の中間の値を示す。

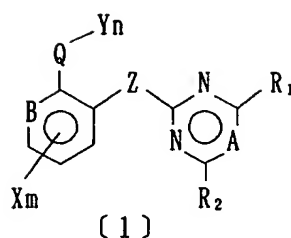
$$\text{殺草率 (\%)} = \frac{(\text{無処理区の地上部生草重} - \text{処理区の地上部生草重})}{\text{無処理区の地上部生草重}} \times 100$$

第 32 表

No.	殺 草 指 数		
	メヒシバ	カヤツリグサ	イヌビユ
8-13	9	10	9
10-11	10	10	10
13-1	10	10	10
13-8	9	10	9
13-56	10	10	10
13-71	10	10	10
13-95	10	10	10
13-110	10	10	10
13-115	9	10	10
13-135	10	10	10
13-137	10	10	10
20-10	8	10	10
27-6	10	10	10

請求の範囲

1. 一般式〔1〕



〔式中、Aは窒素原子、もしくはR₃で置換された炭素原子を表し、

Bは窒素原子、又は水素もしくはXで置換された炭素原子を表し、

Zは酸素、酸化されていても良い硫黄、置換されていても良い窒素、又は置換されていても良い炭素原子を表し、

Qは窒素、酸素もしくは硫黄を1～4個含む5～6員の複素環を表し、かつQの炭素原子でベンゼン環もしくはピリジン環部と結合しており、

R₁、R₂は各々独立して水素、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄ハロアルコキシ、C₁₋₄ハロアルキル、C₁₋₄アルキルアミノ、ジC₁₋₄アルキルアミノ、C₁₋₄アルキルチオ、ハロゲン、シアノ基を表し、

R₃は水素、C₁₋₄アルキル、ハロゲン、ニトロ、ホルミル、アシル基を表し、
又、R₂とR₃は一緒になって環を形成していても良く、

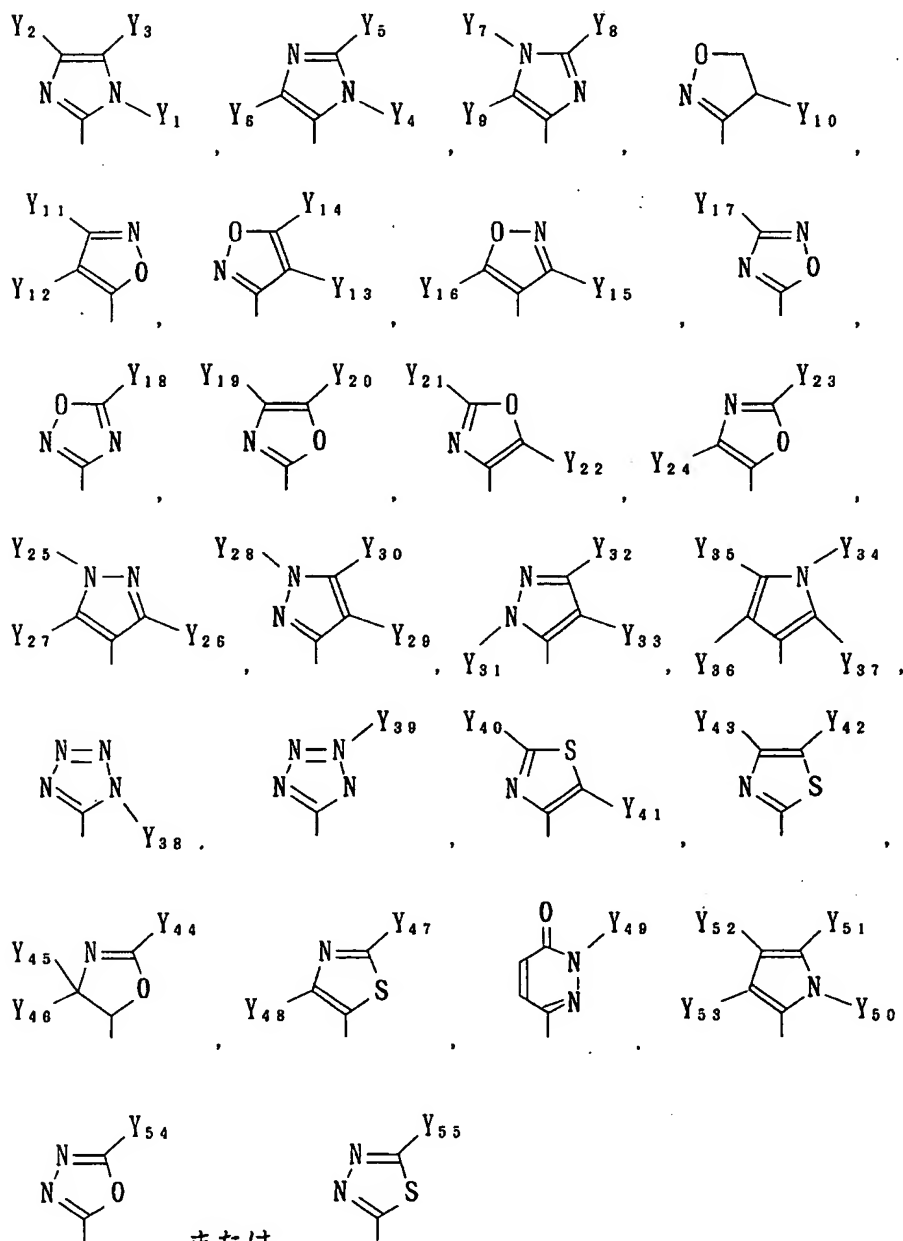
X、Yは各々独立して水素、C₁₋₆アルキル、C₃₋₇シクロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、ハロゲン、ニトロ、アミノ、C₁₋₆アルキルアミノ、アシルアミノ、C₁₋₆アルキルスルホニルアミノ、ホルミル、アシル、シアノ、カルボキシル、イミノ、ヒドロキシル、C₁₋₆アルコキシカルボニル、C₁₋₆アルコキシ、置換されても良いベンジルオキシ、C₂₋₆アルケニルオキシ、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₂₋₆アルケニルオキシ、置換されても良いフェノキシ、置換されても良いベンジル、アミノオキシ、C₁₋₆アルキルチオ、置換されても良いフェニル、C₁₋₆アルキルスルホニル、置換されても良いフェニルチオ、C₂₋₆アルケニルチオ、C₂₋₆アルケニルチオ、置換されても良いベンゾイル、置換されても良いフェニルスルホニル、又は置換されても良い

ヘテロ環-オキシおよびヘテロ環-チオ基を表し、

又、2つのXもしくは2つのYで炭素環、又は複素環を形成してもよく、

m, nは1~4の整数を表す。)で表される複素環誘導体及びその塩。

2. Q-Y_nが、

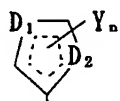


〔式中、Y₁ ~ Y₅₅は水素、C₁₋₆ アルキル、C₃₋₇ シクロアルキル、C₂₋₆

アルケニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルキニル、ハロゲン、ニトロ、アミノ、 C_{1-6} アルキルアミノ、アシルアミノ、 C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ、ホルミル、アシル、シアノ、カルボキシル、イミノ、ヒドロキシル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、 C_{1-6} アルコキシ、置換されても良いベンジルオキシ、 C_{2-6} アルケニルオキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルキニルオキシ、置換されても良いフェノキシ、置換されても良いベンジル、アミノオキシ、 C_{1-6} アルキルチオ、置換されても良いフェニル、 C_{1-6} アルキルスルホニル、置換されても良いフェニルチオ、 C_{2-6} アルケニルチオ、 C_{2-6} アルキニルチオ、置換されても良いベンゾイル、置換されても良いフェニルスルホニル、又は置換されても良いヘテロ環-オキシおよびヘテロ環-チオ基を表し、

又、2つの $Y_1 \sim Y_{55}$ で炭素環、又は複素環を形成してもよい。)である請求項1記載の複素環誘導体及びその塩。

3. $Q-Y_n$ が、



〔式中、—— は単結合または二重結合を表し、

D_1 がNの時は、 D_2 はNY又はOを表し、

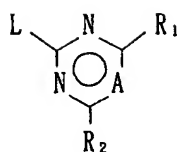
D_1 がNYの時は、 D_2 はCYを表し、

D_1 がOの時は、 D_2 はNを表し、

Y及びnは前記と同じ意味を表す。)である請求項1記載の複素環誘導体及びその塩。

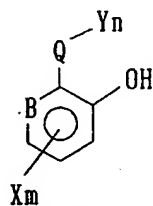
4. Qが、オキサゾール-5-イル又は2-オキサゾリン-5-イル基である請求項1記載の複素環誘導体及びその塩。

5. 一般式〔2〕



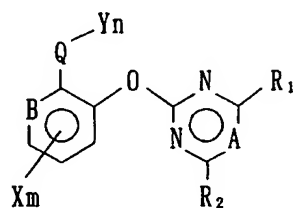
〔2〕

〔式中、 R_1 、 R_2 、 A は前記と同じ意味を表し、 L は脱離基を表す。〕で表される化合物と、一般式〔3〕



〔3〕

〔式中、 B 、 Q 、 X 、 Y 、 m 、 n は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物をカップリングさせる事の特徴とする一般式〔4〕



〔4〕

〔式中、 A 、 B 、 Q 、 R_1 、 R_2 、 X 、 Y 、 m 、 n は前記の意味を表す。〕で表される化合物の製造方法。

6. 請求項1、請求項2、請求項3または請求項4記載の複素環誘導体もしくはその塩の1種又は2種以上を有効成分として含有することを特徴とする除草剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP94/00109

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int. Cl⁵ C07D401/14, 403/10, 403/12, 413/10, 413/12, 417/10, 417/12, A01N43/48, 43/647, 43/72

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int. Cl⁵ C07D401/14, 403/10, 403/12, 413/10, 413/12, 417/10, 417/12, A01N43/48, 43/647, 43/72

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAS ONLINE

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP, A, 4-342586 (Ishihara Sangyo Kaisha, Ltd.), November 30, 1992 (30. 11. 92), Claim, (Family: none)	1-6
A	JP, A, 4-108777 (Kumiai Chemical Industry Co., Ltd.), April 9, 1992 (09. 04. 92), Claim, (Family: none)	1-6
A	JP, A, 3-200784 (Ishihara Sangyo Kaisha, Ltd.), September 2, 1991 (02. 09. 91), Claim, (Family: none)	1-6
A	JP, A, 3-232881 (Mitsui Toatsu Chemicals, Inc.), October 16, 1991 (16. 10. 91), Claim & EP, A1, 435186	1-6
A	JP, A, 1-305070 (Shell International Research), December 8, 1989 (08. 12. 89), Claim & US, A, 5062882	1-6



Further documents are listed in the continuation of Box C.



See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

April 28, 1994 (28. 04. 94)

Date of mailing of the international search report

May 24, 1994 (24. 05. 94)

Name and mailing address of the ISA/

Japanese Patent Office

Facsimile No.

Authorized officer

Telephone No.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.⁸ C07D401/14, 403/10, 403/12, 413/10,
413/12, 417/10, 417/12, A01N43/48,
43/647, 43/72

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.⁸ C07D401/14, 403/10, 403/12, 413/10,
413/12, 417/10, 417/12, A01N43/48,
43/647, 43/72

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用了電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAS ONLINE

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	JP, A, 4-342586 (石原産業株式会社), 30. 11月. 1992 (30. 11. 92), 特許請求の範囲 (ファミリーなし)	1-6
A	JP, A, 4-108777 (クミアイ化学工業株式会社), 9. 4月. 1992 (09. 04. 92), 特許請求の範囲 (ファミリーなし)	1-6
A	JP, A, 3-200784 (石原産業株式会社),	1-6

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日
若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献
(理由を付す)
「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日
の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と
矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のため
に引用するもの
「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規
性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文
献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性
がないと考えられるもの
「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

28. 04. 94

国際調査報告の発送日

24. 05. 94

名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

池田 正 人

4 C 7 6 0 2

電話番号 03-3581-1101 内線 3454

C (続き). 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
	2. 9月. 1991 (02. 09. 91), 特許請求の範囲 (ファミリーなし)	
A	JP, A, 3-232881 (三井東圧化学株式会社), 16. 10月. 1991 (16. 10. 91), 特許請求の範囲 & EP, A1, 435186	1-6
A	JP, A, 1-305070 (シエル・インターナショナル・リサーチ), 8. 12月. 1989 (08. 12. 89), 特許請求の範囲 & US, A, 5062882	1-6

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☒ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☒ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☒ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.

THIS PAGE BLANK (USPTO)